BUNDESREPUBLIK DEUTSCHLAND





RECEIVED

0 2 NOV 2004

WIPO PCT

Prioritätsbescheinigung über die Einreichung einer Patentanmeldung

Aktenzeichen:

103 52 067.8

Anmeldetag:

07. November 2003

Anmelder/Inhaber:

BAYER CropScience AG, 40789 Monheim/DE

Bezeichnung:

Isopentylcarboxanilide

Priorität:

23. Oktober 2003 DE 103 49 498.7

IPC:

C 07 D, C 07 C, A 01 N

Die angehefteten Stücke sind eine richtige und genaue Wiedergabe der ursprünglichen Unterlagen dieser Patentanmeldung.

München, den 23. Juli 2004

Deutsches Patent- und Markenamt

Der Präsident
Im Auftrag

SL___e

.Stremmé

Isopentylcarboxanilide

5

10

Die vorliegende Erfindung betrifft neue Isopentylcarboxanilide, mehrere Verfahren zu deren Herstellung und deren Verwendung zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen.

Es ist bereits bekannt, dass zahlreiche Carboxanilide fungizide Eigenschaften besitzen (vgl. z.B. WO 02/059086, WO 00/09482, EP-A 0 824 099, EP-A 0 755 927, EP-A 0 589 301, EP-A 0 545 099, JP 11-335364, JP 10-310577 und JP 10-251240). So sind beispielsweise 1-Methyl-N-[2-(3-methylbutyl)phenyl]-3-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-4-carboxamid (aus EP-A 0 824 099) und 2,5-Dimethyl-N-[3-(3-methylbutyl)phenyl]-3-furamid aus (EP-A 0 755 927) bekannt. Die Wirksamkeit dieser Stoffe ist gut, lässt aber bei niedrigen Aufwandmengen in manchen Fällen zu wünschen übrig.

Es wurden nun neue Isopentylcarboxanilide der Formel (I)

15 gefunden, in welcher

 R^1

20

25

für
$$R^2$$
 R^2 R^2

wobei die mit * markierte Bindung mit dem Amid verbunden ist, während die mit # markierte Bindung mit der Alkylseitenkette verknüpft ist,

für Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl; C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylsulfonyl, Halogen-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; Formyl, Formyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-Alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, Halogen-(C₁-C₃-alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, Halogen-(C₁-C₃-alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen;

 $(C_1-C_8-Alkyl)$ carbonyl, $(C_1-C_8-Alkoxy)$ carbonyl, $(C_1-C_4-Alkoxy-C_1-C_4-alkyl)$ carbonyl, $(C_3-C_8-Cycloalkyl)$ carbonyl; $(C_1-C_6-Halogenalkyl)$ carbonyl, $(C_1-C_6-Halogenalkoxy)$ carbonyl, $(C_3-C_8-Halogencycloalkyl)$ carbonyl mit

15

20

30

jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; oder -C(=O)C(=O)R⁴, -CONR⁵R⁶ oder -CH₂NR⁷R⁸ steht,

R² für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Methyl oder Trifluormethyl steht,

R³ für Wasserstoff, Halogen, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Halogenalkyl steht,

für Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Alkoxy, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl; C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Halogenalkoxy, Halogen-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen steht,

R⁵ und R⁶ unabhängig voneinander jeweils für Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl; C₁-C₈-Halogenalkyl, Halogen-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Halogen-cycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen stehen,

R⁵ und R⁶ außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C₁-C₄-Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 bis 8 Ringatomen bilden, wobei der Heterocyclus 1
oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR⁹
enthalten kann,

R⁷ und R⁸ unabhängig voneinander für Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl; C₁-C₈-Halogenalkyl, C₃-C₈-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen stehen,

R⁷ und R⁸ außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C₁-C₄-Alkyl
substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 bis 8 Ringatomen bilden, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel
oder NR⁹ enthalten kann,

R⁹ für Wasserstoff oder C₁-C₆-Alkyl steht,

A für den Rest der Formel (A1)

R¹⁰ für Wasserstoff, Hydroxy, Formyl, Cyano, Halogen, Nitro, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkylthio, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkylthio mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen, Aminocarbonyl oder Aminocarbonyl-C₁-C₄-alkyl steht,

R¹¹ für Wasserstoff, Halogen, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkyl oder C₁-C₄-Halogenalkylthio mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen, steht und

R¹² für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, Hydroxy-C₁-C₄-alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₄-Alkylthio-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkylthio-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy-C₁-C₄-alkyl mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen, oder für Phenyl steht,

mit der Maßgabe, dass R^{10} nicht für Iod steht, wenn R^{11} für Wasserstoff steht, und mit der Maßgabe, dass R^{10} nicht für Trifluormethyl oder Difluormethyl steht, wenn R^{3} und R^{11} für Wasserstoff und R^{12} für Methyl stehen,

oder

5

10

A für den Rest der Formel (A2)

R¹³ und R¹⁴ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen stehen und

R¹⁵ für Halogen, Cyano oder C₁-C₄-Alkyl, oder C₁-C₄-Halogenalkyl oder C₁-C₄-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen steht.

oder

A für den Rest der Formel (A3)

R¹⁶ und R¹⁷ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen stehen und

R¹⁸ für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

25 · oder

30

oder

A für den Rest der Formel (A4)

R¹⁹ für Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkylthio mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen steht,

A für den Rest der Formel (A5)

R²⁰ für Halogen, Hydroxy, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkylthio oder C₁-C₄-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen steht und

R²¹ für Wasserstoff, Halogen, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen, C₁-C₄-Alkylsulfinyl oder C₁-C₄-Alkylsulfonyl steht,

oder

5

10 A für den Rest der Formel (A6)

oder

A für den Rest der Formel (A7)

15 R²² für C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht, oder

A für den Rest der Formel (A8)

R²³ für C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

20 oder

A für den Rest der Formel (A9)

 R^{24} und R^{25} unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Amino, C_1 - C_4 -Alkyl oder C_1 - C_4 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht und

25 R²⁶ für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 to 5 Halogenatomen steht,

mit der Maßgabe, dass R^{24} und R^{26} nicht gleichzeitig für Methyl stehen, wenn R^{25} für Wasserstoff steht,

oder

A für den Rest der Formel (A10)

 R^{27} und R^{28} unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Amino, Nitro, C_1 - C_4 -Alkyl oder C_1 - C_4 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen stehen und

R²⁹ für Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A11)

R³⁰ für Wasserstoff, Halogen, Amino, C₁-C₄-Alkylamino, Di-(C₁-C₄-alkyl)amino, Cyano, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht und

R³¹ für Halogen, Hydroxy, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl oder C₁-C₄-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen steht, mit der Maßgabe, dass R³¹ nicht für Trifluormethyl, Difluormethyl oder Methyl steht, wenn R³ für Wasserstoff und R³⁰ für Methyl stehen.

oder

15

20

25

A für den Rest der Formel (A12)

$$\mathbb{R}^{32}$$
 (A12) steht, in welcher

R³² für Wasserstoff, Halogen, Amino, C₁-C₄-Alkylamino, Di-(C₁-C₄-alkyl)amino, Cyano, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht und R³³ für Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A13)

R³⁴ für Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl steht und

R³⁵ für Halogen oder C₁-C₄-Alkyl steht,

oder -

A für den Rest der Formel (A14)

(A14) steht, in welcher

R³⁶ für Wasserstoff, Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

5

A für den Rest der Formel (A15)

(A15) steht, in welcher

R³⁷ für Halogen, Hydroxy, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkylthio oder C₁-C₄-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A16)

(A16) steht, in welcher

15

R³⁸ für Wasserstoff, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, Hydroxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, Di(C₁-C₄-alkyl)aminosulfonyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Phenylsulfonyl oder Benzoyl steht,

- 20

25 '

- R³⁹ für Wasserstoff, Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,
- genatomen steht,

 R⁴⁰ für Wasserstoff, Halogen, Cyano, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5
- R⁴¹ für Wasserstoff, Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

mit der Maßgabe, dass R40 nicht für Trifluormethyl steht,

Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A17)

(A17) steht, in welcher

10

15

 R^{42} für C_1 - C_4 -Alkyl steht.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen können gegebenenfalls als Mischungen verschiedener möglicher isomerer Formen, insbesondere von Stereoisomeren, wie z. B. E- und Z-, threo- und erythro-, sowie optischen Isomeren, gegebenenfalls aber auch von Tautomeren vorliegen. Es werden sowohl die E- als auch die Z-Isomeren, wie auch die threo- und erythro-, sowie die optischen Isomeren, beliebige Mischungen dieser Isomeren, sowie die möglichen tautomeren Formen beansprucht.

Weiterhin wurde gefunden, dass man Isopentylcarboxanilide der Formel (I) erhält, indem man

a) Carbonsäure-Derivate der Formel (II)

in welcher

A die oben angegebenen Bedeutungen hat und

X¹ für Halogen oder Hydroxy steht,

mit einem Anilin-Derivat der Formel (III)

$$HN$$
—L
 R^3
 H_3C
 CH_3
 (III)

in welcher L, R¹ und R³ die oben angegebenen Bedeutungen haben, gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators, gegebenenfalls in Gegenwart eines Kondensationsmittels, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt.

oder

b)

25

Isopentylcarboxanilide der Formel (I-a)

$$A$$
 N
 H_3C
 CH_3
 $(I-a)$

in welcher L, A und R³ die oben angegebenen Bedeutungen haben mit Halogeniden der Formel (IV)

$$R^{1-A} - X^2$$
 (IV)

in welcher

X² für Chlor, Brom oder Iod steht,

für C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl; C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₄-Halogenalkylsulfonyl, Halogen-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; Formyl, Formyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-Alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-Alkoxy)-carbonyl-C₁-C₃-alkyl; Halogen-(C₁-C₃-alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, Halogen-(C₁-C₃-alkyl) mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen;

(C₁-C₈-Alkyl)carbonyl, (C₁-C₈-Alkoxy)carbonyl, (C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl)carbonyl, (C₃-C₈-Cycloalkyl)carbonyl; (C₁-C₆-Halogenalkyl)carbonyl, (C₁-C₆-Halogenalkoxy)carbonyl, (Halogen-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl)carbonyl, (C₃-C₈-Halogencycloalkyl)carbonyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; oder -C(=O)C(=O)R⁴, CONR⁵R⁶ oder -CH₂NR⁷R⁸ steht,

wobei R⁴, R⁵, R⁶, R⁷ und R⁸ die oben angegebenen Bedeutungen haben, in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt,

oder

5

10

15

c) Isopenton-Derivate der Formel (V)

in welcher R¹, R², R³ und A die oben angegebenen Bedeutungen haben, mit Hydrazin (oder Hydrazin-hydrat) in Gegenwart einer Base und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt,

oder

d) Isopenten-Derivate der Formel (VI)

$$\begin{array}{c|c} A & R^2 \\ \hline R^1 & R^3 \\ \hline R_3 & CH_3 \end{array}$$

in welcher R¹, R², R³ und A die oben angegebenen Bedeutungen haben,
gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart
eines Katalysators hydriert,

oder

e) Isopentin-Derivate der Formel (VII)

$$\begin{array}{c|c}
 & R^{3} & CH_{3} \\
 & & CH_{3}
\end{array}$$
(VII)

in welcher R¹, R², R³ und A die oben angegebenen Bedeutungen haben, gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators hydriert.

Schließlich wurde gefunden, dass die neuen Isopentylcarboxanilide der Formel (I) sehr gute mikrobizide Eigenschaften besitzen und zur Bekämpfung unerwünschter Mikroorganismen sowohl im Pflanzenschutz als auch im Materialschutz verwendbar sind.

Die erfindungsgemäßen Isopentylcarboxanilide sind durch die Formel (I) allgemein definiert. Bevorzugte Restedefinitionen der vorstehenden und nachfolgend genannten Formeln sind im Folgenden angegeben. Diese Definitionen gelten für die Endprodukte der Formel (I) wie für alle Zwischenprodukte gleichermaßen.

15

5

- L steht <u>bevorzugt</u> für L-1, wobei R² jeweils die allgemeinen, bevorzugten, besonders bevorzugten, ganz besonders bevorzugten oder insbesondere bevorzugten Bedeutungen haben kann.
- L steht außerdem bevorzugt für L-2.

20 سا

- L steht außerdem bevorzugt für L-3.
- L steht außerdem bevorzugt für L-4.
- L steht <u>besonders bevorzugt</u> für L-1, wobei R² jeweils die allgemeinen, bevorzugten, besonders bevorzugten, ganz besonders bevorzugten oder insbesondere bevorzugten Bedeutungen haben kann.
- 25 L steht außerdem besonders bevorzugt für L-2.
 - L steht ganz besonders bevorzugt für L-1, wobei R² jeweils die allgemeinen, bevorzugten, besonders bevorzugten, ganz besonders bevorzugten oder insbesondere bevorzugten Bedeutungen haben kann.
- 30 R¹ steht <u>bevorzugt</u> für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₄-Alkylsulfinyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, C₁-C₃-Alkoxy-C₁-C₃-alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl; C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkylsulfonyl, C₁-C₄-Halogenalkylsulfonyl, Halogen-C₁-C₃-alkoxy-C₁-C₃-alkyl,

10

15

20

30

35

 R^1

 R^{i}

C₃-C₈-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; Formyl, Formyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-Alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl; Halogen-(C₁-C₃-alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, Halogen-(C₁-C₃-alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen;

(C₁-C₆-Alkyl)carbonyl, (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl, (C₁-C₃-Alkoxy-C₁-C₃-alkyl)carbonyl, (C₃-C₆-Cycloalkyl)carbonyl; (C₁-C₄-Halogenalkyl)carbonyl, (C₁-C₄-Halogenalkoxy)carbonyl, (Halogen-C₁-C₃-alkoxy-C₁-C₃-alkyl)carbonyl, (C₃-C₆-Halogencycloalkyl)carbonyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; oder -C(=O)C(=O)R⁴, -CONR⁵R⁶ oder -CH₂NR⁷R⁸.

steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, n-, iso-, secoder tert-Butyl, Pentyl oder Hexyl, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder iso-Propylsulfinyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder iso-Propylsulfonyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butylsulfonyl, Methoxymethyl, Methoxymethyl, Ethoxyethyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, Trifluorethyl, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluorme-Trifluormethylsulfonyl, Trifluormethoxymethyl; Formyl, thylsulfinyl, -CH₂-CHO, -(CH₂)₂-CHO, -CH₂-CO-CH₃, -CH₂-CO-CH₂CH₃, -CH₂-CO-CH(CH₃)₂, -(CH₂)₂-CO-CH₃, -(CH₂)₂-CO-CH₂CH₃,-(CH₂)₂-CO-CH(CH₃)₂,-CH₂-CO₂CH₃, -CH₂-CO₂CH₂CH₃, -CH₂-CO₂CH(CH₃)₂, $-(CH_2)_2-CO_2CH_3$, $-(CH_2)_2-CO_2CH_2CH_3$, $-(CH_2)_2-CO_2CH(CH_3)_2$, -CH₂-CO-CF₃, -CH₂-CO-CCl₃, -CH₂-CO-CH₂CF₃, -CH₂-CO-CH₂CCl₃, -(CH₂)₂-CO-CH₂CF₃, -(CH₂)₂-CO-CH₂CCl₃, -CH₂-CO₂CH₂CF₃, -CH₂-CO₂CF₂CF₃, -CH₂-CO₂CH₂CCl₃, $-CH_2-CO_2CCl_2CCl_3$, $-(CH_2)_2-CO_2CH_2CF_3$, $-(CH_2)_2-CO_2CF_2CF_3$, -(CH₂)₂-CO₂CH₂CCl₃, -(CH₂)₂-CO₂CCl₂CCl₃;

Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, tert-Butoxycarbonyl, Cyclopropylcarbonyl; Trifluormethylcarbonyl, Trifluormethylcarbonyl, oder -C(=O)C(=O)R⁵, -CONR⁶R⁷ oder -CH₂NR⁸R⁹. steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Methoxymethyl, Formyl, -CH₂-CHO, -(CH₂)₂-CHO, -CH₂-CO-CH₃, -CH₂-CO-CH₂CH₃, -CH₂-CO-CH(CH₃)₂, -C(=O)CHO, -C(=O)C(=O)CH₃, -C(=O)CH₂OCH₃, -C(=O)CO₂CH₃, -C(=O)CO₂CH₃.

Methylcarbonyl, Ethylcarbonyl, n-Propylcarbonyl, iso-Propylcarbonyl, tert-Butylcarbonyl,

R² steht bevorzugt für Wasserstoff.

R² steht außerdem <u>bevorzugt</u> für Fluor, wobei Fluor <u>besonders bevorzugt</u> in 4-, 5- oder 6-Position, <u>ganz besonders bevorzugt</u> in 4- oder 6-Position, <u>insbesondere</u> in 4-Position des Anilidrestes steht [vgl. oben Formel (I)].

30

- R² steht außerdem <u>bevorzugt</u> für Chlor, wobei Chlor <u>besonders bevorzugt</u> in 5-Position des Anilidrestes steht [vgl. oben Formel (I)].
- R² steht außerdem <u>bevorzugt</u> für Methyl, wobei Methyl <u>besonders bevorzugt</u> in 3-Position des Anilidrestes steht [vgl. oben Formel (I)].
- 5 R² steht außerdem <u>bevorzugt</u> für Trifluormethyl, wobei Trifluormethyl <u>besonders bevorzugt</u> in 4- oder 5-Position des Anilidrestes steht [vgl. oben Formel (I)].
 - R³ steht <u>bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl mit 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen.
- steht <u>besonders bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-, iso-Propyl, n-, iso-, sec-, tert-Butyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen.
 - R³ steht <u>ganz besonders bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl oder Trifluormethyl.

steht <u>bevorzugt</u> für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₃-Alkoxy-C₁-C₃-alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl; C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy, Halogen-C₁-C₃-alkoxy-C₁-C₃-alkyl, C₃-C₆-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen.

steht <u>besonders bevorzugt</u> für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, tert-Butyl,
Methoxy, Ethoxy, n- oder iso-Propoxy, tert-Butoxy, Cyclopropyl; Trifluormethyl, Trifluormethoxy.

- R⁵ und R⁶ stehen unabhängig voneinander <u>bevorzugt</u> für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₃-Alkoxy-C₁-C₃-alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl; C₁-C₄-Halogenalkyl, Halogen-C₁-C₃-alkoxy-C₁-C₃-alkyl, C₃-C₆-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen.
- R⁵ und R⁶ bilden außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, <u>bevorzugt</u> einen gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C₁-C₄-Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 bis 8 Ringatomen, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR⁹ enthalten kann.
- R⁵ und R⁶ stehen unabhängig voneinander <u>besonders bevorzugt</u> für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, noder iso-Propyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butyl, Methoxymethyl, Methoxyethyl, Ethoxymethyl, Ethoxyethyl, Cyclopentyl, Cyclopentyl, Cyclopentyl, Trifluormethyl, Trifluormethyl, Trifluormethoxymethyl.
- R⁵ und R⁶ bilden außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, <u>besonders</u> <u>bevorzugt</u> einen gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor,

15

20

Chlor, Brom oder Methyl substituierten gesättigten Heterocyclus aus der Reihe Morpholin, Thiomorpholin oder Piperazin, wobei das Piperazin am zweiten Stickstoffatom durch R⁹ substituiert sein kann.

- 5 R⁷ und R⁸ stehen unabhängig voneinander <u>bevorzugt</u> für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Cycloal-kyl; C₁-C₄-Halogenalkyl, C₃-C₆-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlorund/oder Bromatomen.
 - R⁷ und R⁸ bilden außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, <u>bevorzugt</u> einen gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C₁-C₄-Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 bis 8 Ringatomen, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR⁹ enthalten kann.
 - R⁷ und R⁸ stehen unabhängig vonemander <u>besonders bevorzugt</u> für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, noder iso-Propyl, n., iso., sec. oder tert-Butyl, Methoxymethyl, Methoxyethyl, Ethoxymethyl, Ethoxyethyl, Cyclopentyl, Cyclopentyl, Cyclopentyl, Trifluormethyl, Trifluormethyl, Trifluormethoxymethyl.
 - R⁷ und R⁸ bilden außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, <u>besonders</u>
 <u>bevorzugt</u> einen gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor,
 Chlor, Brom oder Methyl substituierten gesättigten Heterocyclus aus der Reihe Morpholin,
 Thiomorpholin oder Piperazin, wobei das Piperazin am zweiten Stickstoffatom durch R⁹ substituiert sein kann.
 - R⁹ steht <u>bevorzugt</u> für Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl.
 - R⁹ steht <u>besonders bevorzugt</u> für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, n-, iso-, secoder tert-Butyl.
 - A steht <u>bevorzugt</u> für einen der oben angegebenen Reste
 A1, A2, A3, A4, A5, A6, A9, A10, A11, A12, A13, A14, A15 oder A16.
- A steht <u>besonders bevorzugt</u> für einen der oben angegebenen Reste
 A1, A2, A4, A5, A6, A9, A11, A12, A13, A14, A15 oder A16.
 - A steht ganz besonders bevorzugt für den Rest A1.
 - A steht außerdem ganz besonders bevorzugt für den Rest A2.
 - A steht außerdem ganz besonders bevorzugt für den Rest A4.
- 35 A steht außerdem ganz besonders bevorzugt für den Rest A5.
 - A steht außerdem ganz besonders bevorzugt für den Rest A6.

20

30

- A steht außerdem ganz besonders bevorzugt für den Rest A9.
- A steht außerdem ganz besonders bevorzugt für den Rest All.
- A steht außerdem ganz besonders bevorzugt für den Rest A12.
- A steht außerdem ganz besonders bevorzugt für den Rest A13.
- 5 A steht außerdem ganz besonders bevorzugt für den Rest A14.
 - A steht außerdem ganz besonders bevorzugt für den Rest A16.
- steht <u>bevorzugt</u> für Wasserstoff, Hydroxy, Formyl, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, iso-Propyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Cyclopropyl, C₁-C₂-Halogenalkyl, C₁-C₂-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen, Trifluor-methylthio, Difluormethylthio, Aminocarbonyl, Aminocarbonylmethyl oder Aminocarbonylethyl
 - mit der Maßgabe, dass R¹⁰ nicht für Iod steht, wenn R¹¹ für Wasserstoff steht, und mit der Maßgabe, dass R¹⁰ nicht für Trifluormethyl oder Difluormethyl steht, wenn R³ und R¹¹ für Wasserstoff und R¹² für Methyl stehen.
 - R¹⁰ steht <u>besonders bevorzugt</u> für Wasserstoff, Hydroxy, Formyl, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, iso-Propyl, Methoxy, Ethoxy, Monofluormethyl, Monofluorethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Trichlormethyl, Dichlormethyl, Pentafluorethyl, Cyclopropyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethoxy, Difluormethoxy, Trichlormethoxy, Methylthio, Ethylthio, Trifluormethylthio oder Difluormethylthio,
 - mit der Maßgabe, dass R¹⁰ nicht für Iod steht, wenn R¹¹ für Wasserstoff steht, und mit der Maßgabe, dass R¹⁰ nicht für Trifluormethyl oder Difluormethyl steht, wenn R³ und R¹¹ für Wasserstoff und R¹² für Methyl stehen.
 - R¹⁰ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Hydroxy, Formyl, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, iso-Propyl, Methoxy, Cyclopropyl, Monofluormethyl, Monofluorethyl, Difluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Difluorchlormethyl, Trichlormethyl, -CHFCH₃ oder Difluormethoxy,
 - mit der Maßgabe, dass R¹⁰ nicht für Iod steht, wenn R¹¹ für Wasserstoff steht, und mit der Maßgabe, dass R¹⁰ nicht für Trifluormethyl oder Difluormethyl steht, wenn R³ und R¹¹ für Wasserstoff und R¹² für Methyl stehen.
 - R¹⁰ steht <u>insbesondere bevorzugt</u> für Wasserstoff, Hydroxy, Formyl, Chlor, Methyl, Ethyl, Methoxy, Cyclopropyl, Monofluormethyl, Difluormethyl, Dichlormethyl, Trifluormethyl, -CHFCH₃ oder Difluormethoxy,
 - mit der Maßgabe, dass R^{10} nicht für Trifluormethyl oder Difluormethyl steht, wenn R^3 und R^{11} für Wasserstoff und R^{12} für Methyl stehen.

- R¹¹ steht <u>bevorzugt</u> für Wasserstoff, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen,
- R¹¹ steht <u>besonders bevorzugt</u> für Wasserstoff, Chlor, Brom, Iod, Methyl oder -CHFCH₃.
- R¹¹ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Chlor, Methyl oder -CHFCH₃.

5 .

- R¹² steht <u>bevorzugt</u> für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen, Hydroxymethyl, Hydroxyethyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl oder Phenyl.
- steht <u>besonders bevorzugt</u> für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, iso-Propyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Hydroxymethyl, Hydroxyethyl oder Phenyl.
 - R¹² steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Trifluormethyl oder Phenyl.
 - R¹² steht <u>insbesondere bevorzugt</u> für Methyl.
 - R¹³ und R¹⁴ stehen unabhängig voneinander <u>bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
- 15 R¹³ und R¹⁴ stehen unabhängig voneinander <u>besonders bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.
 - R¹³ und R¹⁴ stehen unabhängig voneinander ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl oder Trichlormethyl.
- 20 R¹³ und R¹⁴ stehen insbesondere bevorzugt jeweils für Wasserstoff.

- R¹⁵ steht <u>bevorzugt</u> für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Cyano, Methyl, Ethyl, C₁-C₂-Halogenalkyl oder C₁-C₂-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
- R¹⁵ steht <u>besonders bevorzugt</u> für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Cyano, Methyl, Trifluormethyl, Trifluormethoxy, Difluormethoxy, Difluormethoxy oder Trichlormethoxy.
- R¹⁵ steht ganz besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Trifluormethyl oder Trifluormethoxy.
- R¹⁵ steht insbesondere bevorzugt für Chlor oder Methyl.
- 30 R¹⁶ und R¹⁷ stehen unabhängig voneinander <u>bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
 - R¹⁶ und R¹⁷ stehen unabhängig voneinander <u>besonders bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.
- 35 R¹⁶ und R¹⁷ stehen unabhängig voneinander ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom oder Methyl.

10 .

15

30

35

R¹⁶ und R¹⁷ stehen insbesondere bevorzugt jeweils für Wasserstoff.

- R¹⁸ steht <u>bevorzugt</u> für Wasserstoff, Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
- 5 R¹⁸ steht <u>besonders bevorzugt</u> für Wasserstoff, Methyl oder Trifluormethyl.
 - R¹⁸ steht ganz besonders bevorzugt für Methyl.
 - R¹⁹ steht <u>bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Hydroxy, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₂-Halogenalkyl, C₁-C₂-Halogenalkoxy oder C₁-C₂-Halogenalkylthio mit jeweils 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
 - R¹⁹ steht <u>besonders bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Hydroxy, Cyano, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, sec-Butyl, tert-Butyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethoxy, Difluormethoxy, Trichlormethoxy, Trifluormethylthio, Difluormethylthio, Difluormethylthio, Difluormethylthio, Difluormethylthio.
 - R¹⁹ steht <u>ganz besonders bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Difluormethyl, Trifluormethyl oder Trichlormethyl.
 - R¹⁹ steht insbesondere bevorzugt für Iod, Methyl, Difluormethyl oder Trifluormethyl.
- 20 R²⁰ steht <u>bevorzugt</u> für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Hydroxy, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Difluormethylthio, Trifluormethylthio, C₁-C₂-Halogenalkyl oder C₁-C₂-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
 - R²⁰ steht <u>besonders bevorzugt</u> für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Hydroxy, Cyano, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, sec-Butyl, tert-Butyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluormethyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Difluormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethoxy, Difluormethoxy, Difluormethoxy, Difluormethoxy
 - R²⁰ steht <u>ganz besonders bevorzugt</u> für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.
 - R²¹ steht <u>bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, C₁-C₂-Halogenalkyl oder C₁-C₂-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen, C₁-C₂-Alkylsulfinyl oder C₁-C₂-Alkylsulfonyl.
 - R²¹ steht <u>besonders bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Cyano, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, sec-Butyl, tert-Butyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluor-

15

20

- chlormethyl, Trichlormethyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Trifluormethoxy, Difluormethoxy, Trichlormethoxy, Methylsulfinyl oder Methylsulfonyl.
- R²¹ steht <u>ganz besonders bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, sec-Butyl, tert-Butyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Trichlormethyl, Methylsulfinyl oder Methylsulfonyl.
- R²¹ steht insbesondere bevorzugt für Wasserstoff.
- R²² steht <u>bevorzugt</u> für Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
- steht <u>besonders bevorzugt</u> für Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluormethyl, Difluormethyl, methyl oder Trichlormethyl.
 - steht ganz besonders bevorzugt für Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.
 - R²³ steht <u>bevorzugt</u> für Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
 - R²³ steht <u>besonders bevorzugt</u> für Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.
 - R²³ steht ganz besonders bevorzugt für Methyl; Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.
 - R²⁴ und R²⁵ stehen unabhängig voneinander <u>bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
 - R²⁴ und R²⁵ stehen unabhängig voneinander <u>besonders bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.
 - R²⁴ und R²⁵ stehen unabhängig voneinander ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom oder Methyl.
 - R²⁴ und R²⁵ stehen <u>insbesondere bevorzugt</u> jeweils für Wasserstoff.
- 30 R²⁶ steht <u>bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
 - R²⁶ steht <u>besonders bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, Trifluor-methyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.
 - R²⁶ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Trifluormethyl.
 - R²⁶ steht <u>insbesondere bevorzugt</u> für Methyl oder Trifluormethyl.

- R²⁷ und R²⁸ stehen unabhängig voneinander <u>bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, Nitro, Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
- 5 R²⁷ und R²⁸ stehen unabhängig voneinander <u>besonders bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Nitro, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.
 - R²⁷ und R²⁸ stehen unabhängig voneinander ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.
- 10 R²⁷ und R²⁸ stehen <u>insbesondere bevorzugt</u> jeweils für Wasserstoff.
 - R²⁹ steht <u>bevorzugt</u> für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
 - R²⁹ steht <u>besonders bevorzugt</u> für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.
 - R²⁹ steht ganz besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.
 - R²⁹ steht insbesondere bevorzugt für Methyl.
- 20 R³⁰ steht <u>bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, C₁-C₄-Alkylamino, Di(C₁-C₄-alkyl)amino, Cyano, Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
 - R³⁰ steht <u>besonders bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, Methylamino, Dimethylamino, Cyano, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.
 - R³⁰ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, Methylamino, Dimethylamino, Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.
 - R³⁰ steht <u>insbesondere bevorzugt</u> für Amino, Methylamino, Dimethylamino, Methyl oder Trifluormethyl.
 - R³¹ steht <u>bevorzugt</u> für Fluor, Chlor, Brom, Hydroxy, Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Cyclopropyl, C₁-C₂-Halogenalkyl oder C₁-C₂-Halogenalkoxy mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
- steht <u>besonders bevorzugt</u> für Fluor, Chlor, Brom, Hydroxy, Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Cyclopropyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.

- R³¹ steht <u>ganz besonders bevorzugt</u> für Fluor, Chlor, Brom, Hydroxy, Methyl, Methoxy, Cyclopropyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.
- steht <u>bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, C₁-C₄-Alkylamino, Di(C₁-C₄-alkyl)amino, Cyano, Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
 - R³² steht <u>besonders bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, Methylamino, Dimethylamino, Cyano, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.
 - R³² steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, Methylamino, Dimethylamino, Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.
 - R³² steht <u>insbesondere bevorzugt</u> für Amino, Methylamino, Dimethylamino, Methyl oder Trifluormethyl.
 - R³³ steht <u>bevorzugt</u> für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
 - R³³ steht <u>besonders bevorzugt</u> für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.
- 20 R³³ steht <u>ganz besonders bevorzugt</u> für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.
 - R³³ steht <u>insbesondere bevorzugt</u> für Methyl, Trifluormethyl oder Difluormethyl.
 - R³⁴ steht <u>bevorzugt</u> für Wasserstoff, Methyl oder Ethyl.
 - R³⁴ steht <u>besonders bevorzugt</u> für Methyl.
 - R³⁵ steht bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Ethyl,
 - R³⁵ steht <u>besonders bevorzugt</u> für Fluor, Chlor oder Methyl.
- steht bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
 - R³⁶ steht <u>besonders bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Trifluormethyl.
- steht <u>bevorzugt</u> für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Hydroxy, C₁-C₄-Alkyl, Methoxy, Ethoxy,
 Methylthio, Ethylthio, Difluormethylthio, Trifluormethylthio, C₁-C₂-Halogenalkyl oder C₁C₂-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.

- R³⁷ steht <u>besonders bevorzugt</u> für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, sec-Butyl, tert-Butyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluormethyl, Trichlormethyl.
- R³⁷ steht <u>ganz besonders bevorzugt</u> für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.
 - R³⁸ steht <u>bevorzugt</u> für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C₁-C₂-Alkoxy-C₁-C₂-alkyl, Hydroxymethyl, Hydroxyethyl, methylsulfonyl oder Dimethylaminosulfonyl.
- steht <u>besonders bevorzugt</u> für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Methoxymethyl, Ethoxymethyl, Hydroxymethyl oder Hydroxyethyl.
 - R³⁸ steht ganz besonders bevorzugt für Methyl oder Methoxymethyl.
 - R³⁹ steht <u>bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen.
- 15 R³⁹ steht <u>besonders bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.
 - R³⁹ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff oder Methyl.
- steht <u>bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Methyl, Ethyl, iso-Propyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen.
 - R⁴⁰ steht <u>besonders bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Methyl, Ethyl, iso-Propyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.
 - R⁴⁰ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Methyl oder Trifluormethyl.
 - R⁴¹ steht <u>bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
 - R⁴¹ steht <u>besonders bevorzugt</u> für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl oder Trifluormethyl.
 - R⁴¹ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff oder Trifluormethyl.
 - R⁴² steht <u>bevorzugt</u> für Methyl, Ethyl, n-Propyl oder iso-Propyl,
 - R⁴² steht <u>besonders bevorzugt</u> Methyl oder Ethyl.
- Hervorgehoben sind Verbindungen der Formel (I), in welcher L für L-1 steht, wobei R² die oben angegebenen allgemeinen Bedeutungen hat.

Hervorgehoben sind Verbindungen der Formel (I), in welcher L für L-1 steht, wobei R² die oben angegebenen bevorzugten Bedeutungen hat.

Hervorgehoben sind Verbindungen der Formel (I), in welcher L für L-1 steht, wobei R² die oben angegebenen besonders bevorzugten Bedeutungen hat.

Hervorgehoben sind Verbindungen der Formel (I), in welcher L für L-1 steht, wobei R² die oben angegebenen ganz besonders bevorzugten Bedeutungen hat.

Hervorgehoben sind Verbindungen der Formel (I), in welcher L für L-1 steht, wobei R² die oben angegebenen insbesondere bevorzugten Bedeutungen hat.

Hervorgehoben sind Verbindungen der Formel (I), in welcher L für L-2 steht.

10 Hervorgehoben sind Verbindungen der Formel (I), in welcher R¹ für Wasserstoff steht.

Hervorgehoben sind Verbindungen der Formel (I), in welcher R¹ für Formyl steht.

Hervorgehoben sind außerdem Verbindungen der Formel (I), in welcher R⁴ für -C(=O)C(=O)R⁵ steht, wobei R⁵ die oben angegebenen Bedeutungen hat.

Hervorgehoben sind Verbindungen der Formel (I), in welcher A für A1 steht.

15

35

Gesättigte oder ungesättigte Kohlenwasserstoffreste wie Alkyl oder Alkenyl können, auch in Verbindung mit Heteroatomen, wie z.B. in Alkoxy, soweit möglich, jeweils geradkettig oder verzweigt sein.

Gegebenenfalls substituierte Reste können einfach oder mehrfach substituiert sein, wobei bei 20 Mehrfachsubstitutionen die Substituenten gleich oder verschieden sein können.

Durch Halogen substituierte Reste, wie z.B. Halogenalkyl, sind einfach oder mehrfach halogeniert. Bei mehrfacher Halogenierung können die Halogenatome gleich oder verschieden sein. Halogen steht dabei für Fluor, Chlor, Brom und Iod, insbesondere für Fluor, Chlor und Brom.

Die oben aufgeführten allgemeinen oder in Vorzugsbereichen aufgeführten Restedefinitionen bzw. Erläuterungen können jedoch auch untereinander, also zwischen den jeweiligen Bereichen und Vorzugsbereichen beliebig kombiniert werden. Sie gelten für die Endprodukte sowie für die Vor- und Zwischenprodukte entsprechend.

Die genannten Definitionen können untereinander in beliebiger Weise kombiniert werden. Außerdem können auch einzelne Definitionen entfallen.

Bevorzugt, besonders bevorzugt oder ganz besonders bevorzugt sind Verbindungen der Formel (I), welche jeweils die unter bevorzugt, besonders bevorzugt oder ganz besonders bevorzugt genannten Substituenten tragen.

Beschreibung der erfindungsgemäßen Verfahren zum Herstellen der Isopentylcarboxanilide der Formel (I) sowie der Zwischenprodukte

Verfahren (a)

10

15

25

Verwendet man 5-Fluor-1,3-dimethyl-1H-pyrazol-4-carbonyl-chlorid und [2-(3-Methylbutyl)-phenyl]amin als Ausgangsstoffe, so kann das erfindungsgemäße Verfahren (a) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden:

$$H_3C$$
 $COCI$ H_2N H_3C CH_3 H_3C CH_3 H_3C CH_3

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) als Ausgangsstoffe benötigten Carbonsäure-Derivate sind durch die Formel (II) allgemein definiert. In dieser Formel (II) hat A bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für A angegeben wurden. X¹ steht bevorzugt für Chlor, Brom oder Hydroxy.

Die Carbonsäure-Derivate der Formel (II) sind bekannt und/oder lassen sich nach bekannten Verfahren herstellen (vgl. WO 93/11117, EP-A 0 545 099, EP-A 0 589 301 und EP-A 0 589 313).

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) als Ausgangsstoffe weiterhin benötigten Anilin-Derivate sind durch die Formel (III) allgemein definiert. In dieser Formel (III) haben L, R¹ und R³ bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt angegeben wurden.

Die Anilin-Derivate der Formel (III), in denen L für L-1 steht, sind teilweise neu. Anilin-Derivate der Formel (III), in denen L für L-1 steht, lassen sich herstellen, indem man,

f) Cyanoaniline der Formel (VIII)

in welcher R¹ und R² die oben angegebenen Bedeutungen haben, in einem ersten Schritt mit einem Grignard-Reagenz der Formel (IX)

$$X^3Mg$$
 R^3
 CH_3
(IX)

in welcher

5

10

15

20

R³ die oben angegebenen Bedeutungen hat,

X³ für Chlor, Brom oder Iod steht,
 gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt und die so erhaltenen
 Alkanonaniline der Formel (X)

$$R^{1}$$
 R^{1}
 R^{3}
 CH_{3}
 CH_{3}
 (X)

in welcher R¹, R² und R³ die oben angegebenen Bedeutungen haben, in einem zweiten Schritt mit Hydrazin (oder Hydrazin-hydrat) in Gegenwart einer Base (z.B. Alkali- oder Erdalkalimetallhydroxide wie Natriumhydroxid oder Kaliumhydroxid) und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt.

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (f) als Ausgangsstoffe benötigten Cyanoaniline sind durch die Formel (VIII) allgemein definiert. In dieser Formel (VIII) haben R¹ und R² bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diese Reste angegeben wurden.

Die Cyanoaniline der Formel (VIII) sind bekannt und/oder lassen sich nach bekannten Verfahren herstellen. Cyanoaniline der Formel (VIII), in welcher R¹ nicht für Wasserstoff steht, können erhalten werden, indem man Cyanoaniline der Formel (V-a)

$$H_2N$$
 CN
 $(V-a)$

25 in welcher R² die oben angegebenen Bedeutungen hat, mit Halogeniden der Formel (IV)

$$R^{1-A} X^2$$
 (IV)

in welcher R^{1-A} die oben angegebenen Bedeutungen hat,

in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt. [Die Reaktionsbedingungen des Verfahrens (b) gelten entsprechend.]

- Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (f) als Ausgangsstoffe weiterhin benötigten Grignard-Reagenzien sind durch die Formel (IX) allgemein definiert. In dieser Formel (IX) hat R³ bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) für diesen Rest als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt angegeben wurden.

 X³ steht bevorzugt für Brom.
 - Die Grignard-Reagenzien der Formel (IX) sind bekannt oder können nach bekannten Verfahren erhalten werden.
- Die Alkanonaniline der Formel (X), die im erfindungsgemäßen Verfahren (f) als Zwischenprodukte durchlaufen werden sind neu und ebenfalls Gegenstand dieser Anmeldung. In der Formel (X) haben die Reste R¹, R² und R³ bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt angegeben wurden.
 - Hydrazin (oder Hydrazin-hydrat), welches ebenfalls als Reagenz im erfindungsgemäßen Verfahren (f) benötigt wird, ist eine bekannte Synthesechemikalie.
 - Das erfindungsgemäße Verfahren (f) kann in verschiedenen Varianten durchgeführt werden. So ist es möglich, zunächst Cyanoaniline der Formel (V-a) zu den entsprechenden Alkanonanilinen der Formel (VII-a)

$$H_2N$$
 O
 R^3
 CH_3
 CH_3

in welcher \mathbb{R}^2 und \mathbb{R}^3 die oben angegebenen Bedeutungen haben,

30 umzusetzen, welche dann gegebenenfalls mit Halogeniden der Formel (IV)

$$R^{1-A} - X^2$$
 (IV)

in welcher R1-A die oben angegebenen Bedeutungen hat,

in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels zu den entsprechenden Alkanonaniline der Formel (X) umgesetzt werden. [Die Reaktionsbedingungen des Verfahrens (b) gelten entsprechend.]

5

15

25

Es ist jedoch auch möglich, die Alkanonaniline der Formel (VII-a) gemäß dem erfindungsgemäßen Verfahren (f) zu den entsprechenden Anilin-Derivaten der Formel (III-a)

$$H_2N$$
 R^2
 R^3
 CH_3

in welcher R² und R³ die oben angegebenen Bedeutungen haben,

10 umzusetzen, welche dann gegebenenfalls mit Halogeniden der Formel (IV)

$$R^{1-A} X^2$$
 (IV)

in welcher R1-A die oben angegebenen Bedeutungen hat,

in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels zu den entsprechenden Anilin-Derivaten der Formel (III) umgesetzt werden. [Die Reaktionsbedingungen des Verfahrens (b) gelten entsprechend.]

Anilin-Derivate der Formel (III-b)

$$R^{3-B}$$
 (III-b)

in welcher

20 a) R^{1-B}

für C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl; C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₄-Halogenalkylsulfonyl, Halogen-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; Formyl, Formyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-Alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-Alkoxy)-carbonyl-C₁-C₃-alkyl; Halogen-(C₁-C₃-alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, Halogen-(C₁-C₃-alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, Halogen-(C₁-C₃-alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen;

 $(C_1-C_8-Alkyl) carbonyl, \quad (C_1-C_8-Alkoxy) carbonyl, \quad (C_1-C_4-Alkoxy-C_1-C_4-alkyl)-carbonyl, \quad (C_3-C_8-Cycloalkyl) carbonyl; \quad (C_1-C_6-Halogenalkyl) carbonyl, \quad (C_1-C_6-Halogenalkoxy) carbonyl, \quad (Halogen-C_1-C_4-alkoxy-C_1-C_4-alkyl) carbonyl, \quad (C_3-C_8-Halogencycloalkyl) carbonyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; oder <math>-C(=0)C(=0)R^4$, $CONR^5R^6$ oder $-CH_2NR^7R^8$ steht, und

R^{3-B} für Wasserstoff, Halogen, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Halogenalkyl steht,

oder

5

10

15

20

30

b) R^{1-B} für Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl; C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkylsulfonyl, Halogen-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlorund/oder Bromatomen; Formyl, Formyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-Alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl; Halogen-(C₁-C₃-alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, Halogen-(C₁-C₃-alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen;

(C₁-C₈-Alkyl)carbonyl, (C₁-C₈-Alkoxy)carbonyl, (C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl)-carbonyl, (C₃-C₈-Cycloalkyl)carbonyl; (C₁-C₆-Halogenalkyl)carbonyl, (C₁-C₆-Halogenalkoxy)carbonyl, (Halogen-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl)carbonyl, (C₃-C₈-Halogen-cycloalkyl)carbonyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; oder -C(=O)C(=O)R⁴, CONR⁵R⁶ oder -CH₂NR⁷R⁸ steht, und

R^{3-B} für Halogen, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Halogenalkyl steht,

und

R², R⁴, R⁵, R⁶, R⁷ und R⁸ jeweils die oben angegebenen Bedeutungen haben, sind neu und ebenfalls Gegenstand dieser Anmeldung.

Die bevorzugten, besonders bevorzugten bzw. ganz besonders bevorzugten Bedeutungen von R¹ und R³ finden auf R^{1-B} und R^{3-B} entsprechend Anwendung, wobei im Fall a) R^{1-B} jeweils nicht für Wasserstoff steht und im Fall b) R^{3-B} nicht für Wasserstoff steht. Die bevorzugten, besonders bevorzugten bzw. ganz besonders bevorzugten Bedeutungen von R², R⁴, R⁵, R⁶, R⁷ und R⁸ gelten ebenfalls für die neuen Verbindungen der Formel (III-b).

Hervorgehoben sind Verbindungen der Formel (III-b), in welcher R¹ und R² jeweils für Wasserstoff und R³ für Fluor, Chlor, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl oder Pentafluorethyl steht.

- 35 Anilin-Derivate der Formel (III), in denen L für L-1 steht, werden außerdem erhalten, indem man
 - g) Anilinhalogenide der Formel (XI)

$$\begin{array}{cccc}
& & & \\
& & & \\
& & & \\
R_1^{1-A} & X^4
\end{array} (XI)$$

in welcher

R^{1-A} und R² die oben angegebenen Bedeutungen haben und

X⁴ für Halogen steht,

in einem ersten Schritt mit Alkinen der Formel (XII)

$$H \xrightarrow{\mathbb{R}^3 \times \mathbb{C}H_3} (XII)$$

in welcher R3 die oben angegebenen Bedeutungen hat,

in Gegenwart eines Katalysators, gegebenenfalls in Gegenwart einer Base und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt und in einem zweiten Schritt die so erhaltenen Alkinaniline der Formel (XIII)

$$\begin{array}{c|c}
R^{2} & CH_{3} \\
\hline
N-R^{1-A} & CH_{3}
\end{array}$$
(XIII)

in welcher R^{1-A}, R² und R³ die oben angegebenen Bedeutungen haben gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators hydriert.

15 .

20

5

10

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (g) als Ausgangsstoffe benötigten Anilinhalogenide sind durch die Formel (XI) allgemein definiert. In dieser Formel (XI) hat R² bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diesen Rest angegeben wurden. R^{1-A} hat bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die im Zusammenhang mit der Beschreibung der Verbindungen der Formel (IV) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diesen Rest angegeben sind.

25

Die Anilinhalogenide der Formel (XI) sind bekannt und/oder können nach bekannten Verfahren, z.B. aus den entsprechenden am Stickstoff unsubstituierten Derivaten durch Umsetzung mit den Halogeniden der Formel (IV), erhalten werden.

15

20

30

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (g) als Ausgangsstoffe weiterhin benötigten Alkine sind durch die Formel (XII) allgemein definiert. In dieser Formel (XII) hat R³ bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diesen Rest angegeben wurden.

Die Alkine der Formel (XII) sind bekannt.

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (g) als Zwischenprodukte durchlaufenen Alkinaniline sind durch die Formel (XIII) allgemein definiert. In dieser Formel (XIII) haben R² und R³ bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diese Reste angegeben wurden. R1-A hat bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die im Zusammenhang mit der Beschreibung der Verbindungen der Formel (IV) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diesen Rest angegeben sind.

Die Alkinaniline der Formel (XIII) sind teilweise bekannt. Sie werden nach dem erfindungsgemäßen Verfahren (g) erhalten.

Sollen Anilin-Derivate der Formel (III), in welcher R¹ für Wasserstoff steht, erhalten werden, so wird R^{1-A} entsprechend ausgewählt, um die Funktion einer Schutzgruppe zu erfüllen, welche im Anschluss an das erfindungsgemäße Verfahren (g) nach üblichen Methoden wieder entfernt werden kann.

Die Anilin-Derivate der Formel (III), in denen L für L-2, L-3 oder L-4 steht, sind bekannt und/oder können nach bekannten Verfahren erhalten werden (vgl. z.B. EP-A 1 036 793 und EP-A 0 737 682).

Anilin-Derivate der Formel (III), in denen L für L-2, L-3 oder L-4 steht und R¹ nicht für Wasserstoff steht, können erhalten werden, indem man Aniline der Formel (III-c)

$$H_2N$$
 H_3C
 CH_3
 CH_3
 CH_3
 CH_3

in welcher

L¹ für L-2, L-3 oder L-4 steht und
L-2, L-3, L-4 und R³ die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit Halogeniden der Formel (IV)

$$R^{1-A} X^2$$
 (IV)

in welcher R1-A und X2 die oben angegebenen Bedeutungen hat,

in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt. [Die Reaktionsbedingungen des Verfahrens (b) gelten entsprechend.]

Verfahren (b)

5

10

15

25

30

R1-A

Verwendet man 5-Fluor-1,3-dimethyl-N-[2-(3-methylbutyl)phenyl]-1H-pyrazol-4-carboxamid und Ethyl-chlor(oxo)acetat als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden:

$$H_3C$$
 H_3C
 CH_3
 CH_3
 CH_3
 H_3C
 C_2H_5
 C_2H_5
 C_2H_5

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) als Ausgangsstoffe benötigten Isopentylcarboxanilide sind durch die Formel (I-a) allgemein definiert. In dieser Formel (I-a) haben R^2 , R^3 und A bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diese Reste angegeben wurden.

Die Isopentylcarboxanilide der Formel (I-a) sind ebenfalls erfindungsgemäße Verbindungen und ebenfalls Gegenstand dieser Anmeldung. Sie können nach einem der erfindungsgemäßen Verfahren (a), (c), (d) oder (e) erhalten werden (mit R¹ = Wasserstoff).

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) als Ausgangsstoffe weiterhin benötigten Halogenide sind durch die Formel (IV) allgemein definiert.

steht <u>bevorzugt</u> für C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₄-Alkylsulfinyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, C₁-C₃-Alkoxy-C₁-C₃-alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl; C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₄-Halogenalkylsulfonyl, Halogen-C₁-C₃-alkoxy-C₁-C₃-alkyl, C₃-C₈-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; Formyl, Formyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-Alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl; Halogen-(C₁-C₃-alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, Halogen-(C₁-C₃-alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen;

10

15

20

30

R1-A

(C₁-C₆-Alkyl)carbonyl, (C₁-C₄-Alkoxy)carbonyl, (C₁-C₃-Alkoxy-C₁-C₃-alkyl)carbonyl, (C₃-C₆-Cycloalkyl)carbonyl; (C₁-C₄-Halogenalkyl)carbonyl, (C₁-C₄-Halogenalkoxy)carbonyl, (Halogen-C₁-C₃-alkoxy-C₁-C₃-alkyl)carbonyl, (C₃-C₆-Halogencycloalkyl)carbonyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; oder -C(=O)C(=O)R⁴, -CONR⁵R⁶ oder -CH₂NR⁷R⁸.

steht besonders bevorzugt für Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butyl, Pentyl oder Hexyl, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder iso-Propylsulfinyl, n-, iso-, secoder tert-Butylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder iso-Propylsulfonyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butylsulfonyl, Methoxymethyl, Methoxyethyl, Ethoxymethyl, Ethoxymethyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Trifluormethyl, Trifluorethyl, Trifluorethyl, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl, Trifluormethylsulfonyl, Trifluormethoxymethyl; Formyl, -CH₂-CHO, -(CH₂)₂-CHO, -CH₂-CO-CH₂CH₃, -CH₂-CO-CH(CH₃)₂, -(CH₂)₂-CO-CH₃,-CH₂-CO-CH₃, -(CH₂)₂-CO-CH₂CH₃, -(CH₂)₂-CO-CH(CH₃)₂, -CH2-CO2CH3, -CH₂-CO₂CH₂CH₃, $-CH_2-CO_2CH(CH_3)_2$, $-(CH_2)_2-CO_2CH_3$, $-(CH_2)_2-CO_2CH_2CH_3$, $-(CH_2)_2-CO_2CH(CH_3)_2$, -CH₂-CO-CF₃, -CH₂-CO-CCl₃, -CH₂-CO-CH₂CF₃, -CH₂-CO-CH₂CCl₃, -(CH₂)₂-CO-CH₂CF₃, -(CH₂)₂-CO-CH₂CCl₃, -CH₂-CO₂CH₂CF₃, -CH₂-CO₂CF₂CF₃, -CH₂-CO₂CH₂CCl₃, -CH₂-CO₂CCl₂CCl₃, -(CH₂)₂-CO₂CH₂CF₃,-(CH₂)₂-CO₂CF₂CF₃,-(CH₂)₂-CO₂CH₂CCl₃,-(CH₂)₂-CO₂CCl₂CCl₃;

Methylcarbonyl, Ethylcarbonyl, n-Propylcarbonyl, iso-Propylcarbonyl, tert-Butylcarbonyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, tert-Butoxycarbonyl, Cyclopropylcarbonyl; Trifluormethylcarbonyl, Trifluormethoxycarbonyl, oder -C(=O)C(=O)R⁵, -CONR⁶R⁷ oder -CH₂NR⁸R⁹.

R^{1-A} steht <u>ganz besonders bevorzugt</u> für Methyl, Methoxymethyl, Formyl, -CH₂-CHO, -(CH₂)₂-CHO, -CH₂-CO-CH₃, -CH₂-CO-CH₂CH₃, -CH₂-CO-CH(CH₃)₂, -C(=O)CHO, -C(=O)C(=O)CH₃, -C(=O)C(=O)CH₂OCH₃, -C(=O)CO₂CH₃, -C(=O)CO₂CH₃.

X² steht bevorzugt für Chlor oder Brom.

Halogenide der Formel (IV) sind bekannt.

Verfahren (c)

Verwendet man 2-Iod-N-[2-(3-methylbutanoyl)phenyl]benzamid als Ausgangsstoff, sowie Hydrazin und eine Base so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden:

10

15

20

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) als Ausgangsstoffe benötigten Isopenton-Derivate sind durch die Formel (V) allgemein definiert. In dieser Formel (V) haben R¹, R², R³ und A bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diese Reste angegeben wurden.

Die Isopenton-Derivate der Formel (V) sind neu. Sie werden erhalten, indem man

h) Carbonsäure-Derivate der Formel (II)

in welcher

A die oben angegebenen Bedeutungen hat und

X¹ für Halogen oder Hydroxy steht,
 mit Alkanonanilinen der Formel (X)

$$R^{1}$$
 R^{1}
 R^{3}
 CH_{3}
 CH_{3}
 CH_{3}
 CH_{3}

in welcher R¹, R² und R³ die oben angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators, gegebenenfalls in Gegenwart eines Kondensationsmittels, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt.

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (h) als Ausgangsstoffe benötigten Carbonsäure-Derivate der Formel (II) wurden bereits im Zusammenhang mit dem erfindungsgemäßen Verfahren (a) beschrieben.

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (h) weiterhin als Ausgangsstoffe benötigten Alkanonaniline der Formel (X) wurden bereits im Zusammenhang mit dem erfindungsgemäßen Verfahren (f) beschrieben.

Verfahren (d)

5

15

20

Verwendet man N-{2-[3,3-Dimethylbut-1-en-1-yl]phenyl}-5-fluor-1,3-dimethyl-1H-pyrazol-4-carboxamid als Ausgangsstoff, sowie Wasserstoff so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (d) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden:

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (d) als Ausgangsstoffe benötigten Isopenten-Derivate sind durch die Formel (VI) allgemein definiert. In dieser Formel (VI) haben R¹, R², R³ und A bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diese Reste angegeben wurden.

Die Isopenten-Derivate der Formel (VI) sind neu. Sie werden erhalten, indem man

j) Carboxamide der Formel (XIV)

$$A = \begin{pmatrix} 0 & & & \\ N & & & \\ R^1 & & X^5 \end{pmatrix}$$
 (XIV)

in welcher

 $\ensuremath{R^1}\xspace, \ensuremath{R^2}\xspace$ und $\ensuremath{A}\xspace$ die oben angegebenen Bedeutungen haben und

X⁵ für Chlor, Brom, Iod oder -OSO₂CF₃ steht, mit Alkenen der Formel (XV)

$$R^3$$
 CH_3 (XV)

in welcher R3 die oben angegebenen Bedeutungen hat,

in Gegenwart eines Katalysators, gegebenenfalls in Gegenwart einer Base und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt.

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (j) als Ausgangsstoffe benötigten Carboxamide sind durch die Formel (XIV) allgemein definiert. In dieser Formel (XIV) haben R¹, R² und A bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel

(I) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diese Reste angegeben wurden. X⁵ steht bevorzugt für Brom oder -OSO₂CF₃.

Die Carboxamide der Formel (XIV) sind bekannt oder können nach bekannten Methoden erhalten werden (vgl. WO 02/08195 und WO 02/08197).

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (j) als Ausgangsstoffe weiterhin benötigten Alkene sind durch die Formel (XV) allgemein definiert. In dieser Formel (XV) hat R³ bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diesen Rest angegeben wurden.

Die Alkene der Formel (XV) sind bekannt.

Verfahren (e)

5

10

15

25

Verwendet man N-[2-(3,3-Dimethylbut-1-in-1-yl)phenyl]-5-fluor-1,3-dimethyl-1H-pyrazol-4-carb-oxamid als Ausgangsstoff, sowie Wasserstoff so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (e) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden:

$$H_3C$$
 H_3C
 H_3C

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (e) als Ausgangsstoffe benötigten Isopentin-Derivate sind durch die Formel (VII) allgemein definiert. In dieser Formel (VII) haben R¹, R², R³ und A bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diese Reste angegeben wurden.

Die Isopentin-Derivate der Formel (VII), in welcher A nicht für A1 steht, sind neu. Die Isopentin-Derivate der Formel (VII) werden erhalten, indem man

k) Carboxamide der Formel (XIV)

in welcher

5

10

25

 $\ensuremath{R^1}\xspace, \ensuremath{R^2}\xspace$ und A die oben angegebenen Bedeutungen haben und

X⁵ für Chlor, Brom, Iod oder -OSO₂CF₃ steht, mit Alkinen der Formel (XII)

$$H \xrightarrow{R^3 \subset H_3} (XII)$$

in welcher R3 die oben angegebenen Bedeutungen hat,

in Gegenwart eines Katalysators, gegebenenfalls in Gegenwart einer Base und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt.

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (k) als Ausgangsstoffe benötigten Carboxamide der Formel (XIV) sind bereits im Zusammenhang mit dem erfindungsgemäßen Verfahren (j) beschrieben worden.

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (k) als Ausgangsstoffe weiterhin benötigten Alkine der Formel (XII) sind bereits im Zusammenhang mit dem erfindungsgemäßen Verfahren (g) beschrieben worden.

Reaktionsbedingungen

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (a) und (h) kommen alle inerten organischen Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-t-Amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol oder Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid.

Die erfindungsgemäßen Verfahren (a) und (h) werden gegebenenfalls in Gegenwart eines geeigneten Säureakzeptors durchgeführt. Als solche kommen alle üblichen anorganischen oder organischen Basen infrage. Hierzu gehören vorzugsweise Erdalkalimetall- oder Alkalimetallhydride, -hydroxide,

-amide, -alkoholate, -acetate, -carbonate oder -hydrogencarbonate, wie beispielsweise Natrium-hydrid, Natriumamid, Natrium-methylat, Natrium-ethylat, Kalium-tert.-butylat, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Ammoniumhydroxid, Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, Ammonium-acetat, Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat, Natriumhydrogencarbonat oder Ammoniumcarbonat, sowie tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, N,N-Dimethyl-benzylamin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU).

Die erfindungsgemäßen Verfahren (a) und (h) werden gegebenenfalls in Gegenwart eines geeigneten Kondensationsmittels durchgeführt. Als solche kommen alle üblicherweise für derartige Amidierungsreaktionen verwendbaren Kondensationsmittel infrage. Beispielhaft genannt seien Säurehalogenidbildner wie Phosgen, Phosphortribromid, Phosphortrichlorid, Phosphorpentachlorid, Phosphoroxychlorid oder Thionylchlorid; Anhydridbildner wie Chlorameisensäureethylester, Chlorameisensäureisopropylester, Chlorameisensäureisobutylester oder Methansulfonylchlorid; Carbodiimide, wie N,N'-Dicyclohexylcarbodiimid (DCC) oder andere übliche Kondensationsmittel, wie Phosphorpentoxid, Polyphosphorsäure, N,N'-Carbonyldiimidazol, 2-Ethoxy-N-ethoxycarbonyl-1,2-dihydrochinolin (EEDQ), Triphenylphosphin/Tetrachlorkohlenstoff oder Brom-tripyrrolidinophosphonium-hexafluorophosphat.

20

. 15

10

Die erfindungsgemäßen Verfahren (a) und (h) werden gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators durchgeführt. Beispielsweise genannt seien 4-Dimethylaminopyridin, 1-Hydroxy-benzotriazol oder Dimethylformamid.

30

35

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (a) und (h) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen von 0°C bis 150°C, vorzugsweise bei Temperaturen von 0°C bis 80°C.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I) setzt man pro mol des Carbonsäure-Derivates der Formel (II) im allgemeinen 0,2 bis 5 mol, vorzugsweise 0,5 bis 2 mol an Anilin-Derivat der Formel (III) ein.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (h) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (V) setzt man pro mol des Carbonsäure-Derivates der Formel (II) im allgemeinen 0,2 bis 5 mol, vorzugsweise 0,5 bis 2 mol an Alkanonanilin der Formel (X) ein.

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) kommen alle inerten organischen Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-tertbutylether, Methyl-tert-Amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2- Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol oder Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid.

10

15

Das erfindungsgemäße Verfahren (b) wird in Gegenwart einer Base durchgeführt. Als solche kommen alle üblichen anorganischen oder organischen Basen infrage. Hierzu gehören vorzugsweise Erdalkalimetall- oder Alkalimetallhydride, -hydroxide, -amide, -alkoholate, -acetate, -carbonate oder -hydrogencarbonate, wie beispielsweise Natriumhydrid, Natriumamid, Natrium-methylat, Natriumethylat, Kalium-tert.-butylat, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Ammoniumhydroxid, Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, Ammoniumacetat, Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat, Natriumhydrogencarbonat oder Caesiumcarbonat, sowie tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, N,N-Dimethyl-benzylamin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU).

20

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen von 0°C bis 150°C, vorzugsweise bei Temperaturen von 20°C bis 110°C.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I) setzt man pro Mol des Isopentylcarboxanilids der Formel (I-a) im allgemeinen 0,2 bis 5 Mol, vorzugsweise 0,5 bis 2 Mol an Halogenid der Formel (IV) ein.

30

35

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) sowie des zweiten Schrittes von Verfahren (f) kommen alle inerten organischen Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlorbenzol, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-t-Amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2- Dimeth-

15

20

30

oxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Ketone, wie Aceton, Butanon, Methyl-isobutylketon oder Cyclohexanon; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid; Sulfone, wie Sulfolan; Alkohole, wie Methanol, Ethanol, n- oder i-Propanol, n-, i-, sek- oder tert-Butanol, Ethandiol, Propan-1,2-diol, Ethoxyethanol, Methoxyethanol, Diethylenglykolmonomethylether, Diethylenglykolmonoethylether, Triethylenglykol, deren Gemische mit Wasser oder reines Wasser.

Das erfindungsgemäße Verfahren (c) sowie des zweiten Schrittes von Verfahren (f) wird in Gegenwart einer Base durchgeführt. Als solche kommen vorzugsweise Erdalkalimetall- oder Alkalimetallhydroxide, wie beispielsweise Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Ammoniumhydroxid infrage.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) sowie des zweiten Schrittes von Verfahren (f) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen von 100°C bis 300°C, vorzugsweise bei Temperaturen von 150°C bis 250°C.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I) setzt man pro Mol des Isopenton-Derivatives der Formel (V) im allgemeinen 0,2 bis 5 Mol, vorzugsweise 0,5 bis 3 Mol an Hydrazin (oder Hydrazin-hydrat) ein.

Zur Durchführung des zweiten Schrittes von Verfahren (f) zur Herstellung der Verbindungen der Anilin-Derivate der Formel (III) setzt man pro Mol des Alkanonanilines der Formel (X) im allgemeinen 0,2 bis 5 Mol, vorzugsweise 0,5 bis 3 Mol an Hydrazin (oder Hydrazin-hydrat) ein.

Als Verdümungsmittel zur Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (d) und (e) sowie des zweiten Schrittes von Verfahren (g) kommen alle inerten organischen Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise aliphatische oder alicyclische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan oder Decalin; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-t-Amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2- Dimethoxyethan oder 1,2-Diethoxyethan; Alkohole, wie Methanol, Ethanol, n- oder iso-Propanol, n-, iso-, sec- oder tert-Butanol, Ethandiol, Propan-1,2-diol, Ethoxyethanol, Methoxyethanol, Diethylenglykolmonomethylether, Diethylenglykolmonoethylether, deren Gemische mit Wasser oder reines Wasser.

Die erfindungsgemäßen Verfahren (d) und (e) sowie der zweite Schritt von Verfahren (g) werden in Gegenwart eines Katalysators durchgeführt. Als solche kommen alle Katalysatoren infrage, die für

15

20

30

35

Hydrierungen üblicherweise verwendet werden. Beispielhaft seien genannt: Raney-Nickel, Palladium oder Platin, gegebenenfalls auf einem Trägermaterial, wie beispielsweise Aktivkohle.

Die Hydrierung in den erfindungsgemäßen Verfahren (d) und (e) sowie im zweiten Schritt von Verfahren (g) kann statt in Gegenwart von Wasserstoff in Kombination mit einem Katalysator auch in Anwesenheit von Triethylsilan durchgeführt werden.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (d) und (e) sowie des zweiten Schrittes von Verfahren (g) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen von 0°C bis 150°C, vorzugsweise bei Temperaturen von 20°C bis 100°C.

Die erfindungsgemäßen Verfahren (d) und (e) sowie der zweite Schritt von Verfahren (g) werden unter einem Wasserstoffdruck zwischen 0.5 and 200 bar, bevorzugt zwischen 2 und 50 bar, besonders bevorzugt zwischen 3 und 10 bar durchgeführt.

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des ersten Schrittes von Verfahren (f) kommen alle inerten organischen Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise aliphatische oder alicyclische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan oder Decalin; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-t-Amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2- Dimethoxyethan oder 1,2-Diethoxyethan.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des ersten Schrittes von Verfahren (f) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen von 0°C bis 200°C, vorzugsweise bei Temperaturen von 20°C bis 150°C.

Zur Durchführung des ersten Schrittes von Verfahren (f) zur Herstellung der Verbindungen der Alkanonaniline der Formel (X) setzt man pro Mol des Cyanoanilines der Formel (VIII) im allgemeinen 0,2 bis 5 Mol, vorzugsweise 0,5 bis 3 Mol an Grignard-Reagenz der Formel (IX) ein.

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des ersten Schrittes von Verfahren (g) und der erfindungsgemäßen Verfahren (j) und (k) kommen alle inerten organischen Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonitril oder Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether,

Methyl-t-butylether, Methyl-t-Amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2- Dimethoxyethan oder 1,2- Diethoxyethan.

Der erste Schritt von Verfahren (g) und die erfindungsgemäßen Verfahren (j) und (k) werden gegebenenfalls in Gegenwart eines geeigneten Säureakzeptors durchgeführt. Als solche kommen alle üblichen anorganischen oder organischen Basen infrage. Hierzu gehören vorzugsweise Erdalkalimetall- oder Alkalimetallhydride, -hydroxide, -amide, -alkoholate, -acetate, -carbonate oder -hydrogencarbonate, wie beispielsweise Natriumhydrid, Natriumamid, Natrium-methylat, Natrium-ethylat, Kalium-tert.-butylat, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Ammoniumhydroxid, Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, Ammoniumacetat, Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat oder Ammoniumcarbonat, sowie tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylamin, N,N-Dimethyl-benzylamin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU).

15 ·

20

10

5

Der erste Schritt von Verfahren (g) und die erfindungsgemäßen Verfahren (j) und (k) werden in Gegenwart eines oder mehrerer Katalysatoren durchgeführt.

Dazu eignen sich besonders Palladiumsalze oder -komplexe. Hierzu kommen vorzugsweise Palladiumchlorid, Palladiumacetat, Tetrakis-(triphenylphosphin)-Palladium oder Bis-(triphenylphosphin)-Palladiumdichlorid infrage. Es kann auch ein Palladiumkomplex in der Reaktionsmischung erzeugt werden, wenn man ein Palladiumsalz und ein Komplexligand getrennt zur Reaktion zugibt.

25

Als Liganden kommen vorzugsweise Organophosphorverbindungen infrage. Beispielhaft seien genannt: Triphenylphosphin, tri-o-Tolylphosphin, 2,2'-Bis(diphenylphosphino)-1,1'-binaphthyl, Dicyclohexylphosphinebiphenyl, 1,4-Bis(diphenylphosphino)butan, Bisdiphenylphosphinoferrocen, Di(tert.-butylphosphino)biphenyl, Di(cyclohexylphosphino)biphenyl, 2-Dicyclohexylphosphino-2'-N,N-dimethylaminobiphenyl, Tricyclohexylphosphin, Tri-tert.-butylphosphin. Es kann aber auch auf Liganden verzichtet werden.

30

Der erste Schritt von Verfahren (g) und die erfindungsgemäßen Verfahren (j) und (k) werden ferner gegebenenfalls in Gegenwart eines weiteren Metallsalzes, wie Kupfersalzen, beispielsweise Kupfer-(I)-iodid durchgeführt.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des ersten Schrittes von Verfahren (g) und der erfindungsgemäßen Verfahren (j) und (k) in einem größeren Bereich variiert werden. Im

allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen von 20°C bis 180°C, vorzugsweise bei Temperaturen von 50°C bis 150°C.

Zur Durchführung des ersten Schrittes von Verfahren (g) zur Herstellung der Anilin-Derivate der Formel (III) setzt man pro Mol des Anilinhalogenides der Formel (XI) im allgemeinen 1 bis 5 mol, vorzugsweise 1 bis 3 mol an Alkin der Formel (XII) ein.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (j) zur Herstellung der Isopenten-Derivate der Formel (VI) setzt man pro Mol des Carboxamids der Formel (XIV) im allgemeinen 1 bis 5 mol, vorzugsweise 1 bis 3 mol an Alken der Formel (XV) ein.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (k) zur Herstellung der Isopentin-Derivate der Formel (VII) setzt man pro Mol des Carboxamids der Formel (XIV) im allgemeinen 1 bis 5 mol, vorzugsweise 1 bis 3 mol an Alkin der Formel (XII) ein.

15

20

30

Wenn nicht anders angegeben, werden alle erfindungsgemäßen Verfahren im Allgemeinen unter Normaldruck durchgeführt. Es ist jedoch auch möglich, unter erhöhtem oder vermindertem Druck – im Allgemeinen zwischen 0,1 bar und 10 bar – zu arbeiten.

Die erfindungsgemäßen Stoffe weisen eine starke mikrobizide Wirkung auf und können zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen, wie Fungi und Bakterien, im Pflanzenschutz und im Materialschutz eingesetzt werden.

Fungizide lassen sich Pflanzenschutz zur Bekämpfung von Plasmodiophoromycetes, Oomycetes, Chytridiomycetes, Zygomycetes, Ascomycetes, Basidiomycetes und Deuteromycetes einsetzen.

Bakterizide lassen sich im Pflanzenschutz zur Bekämpfung von Pseudomonadaceae, Rhizobiaceae, Enterobacteriaceae, Corynebacteriaceae und Streptomycetaceae einsetzen.

Beispielhaft aber nicht begrenzend seien einige Erreger von pilzlichen und bakteriellen Erkrankungen, die unter die oben aufgezählten Oberbegriffe fallen, genannt:

Xanthomonas-Arten, wie beispielsweise Xanthomonas campestris pv. oryzae;

Pseudomonas-Arten, wie beispielsweise Pseudomonas syringae pv. lachrymans;

Erwinia-Arten, wie beispielsweise Erwinia amylovora;

Pythium-Arten, wie beispielsweise Pythium ultimum;

Phytophthora-Arten, wie beispielsweise Phytophthora infestans;
 Pseudoperonospora-Arten, wie beispielsweise Pseudoperonospora humuli oder

Pseudoperonospora cubensis;

Plasmopara-Arten, wie beispielsweise Plasmopara viticola;

Bremia-Arten, wie beispielsweise Bremia lactucae;

Peronospora-Arten, wie beispielsweise Peronospora pisi oder P. brassicae;

5 Erysiphe-Arten, wie beispielsweise Erysiphe graminis;

Sphaerotheca-Arten, wie beispielsweise Sphaerotheca fuliginea;

Podosphaera-Arten, wie beispielsweise Podosphaera leucotricha;

Venturia-Arten, wie beispielsweise Venturia inaequalis;

Pyrenophora-Arten, wie beispielsweise Pyrenophora teres oder P. graminea

10 (Konidienform: Drechslera, Syn: Helminthosporium);

Cochliobolus-Arten, wie beispielsweise Cochliobolus sativus

(Konidienform: Drechslera, Syn: Helminthosporium);

Uromyces-Arten, wie beispielsweise Uromyces appendiculatus;

Puccinia-Arten, wie beispielsweise Puccinia recondita;

15 Sclerotinia-Arten, wie beispielsweise Sclerotinia sclerotiorum;

Tilletia-Arten, wie beispielsweise Tilletia caries;

Ustilago-Arten, wie beispielsweise Ustilago nuda oder Ustilago avenae;

Pellicularia-Arten, wie beispielsweise Pellicularia sasakii;

Pyricularia-Arten, wie beispielsweise Pyricularia oryzae;

20 Fusarium-Arten, wie beispielsweise Fusarium culmorum;

Botrytis-Arten, wie beispielsweise Botrytis cinerea;

Septoria-Arten, wie beispielsweise Septoria nodorum;

Leptosphaeria-Arten, wie beispielsweise Leptosphaeria nodorum;

Cercospora-Arten, wie beispielsweise Cercospora canescens;

Alternaria-Arten, wie beispielsweise Alternaria brassicae;

30

Pseudocercosporella-Arten, wie beispielsweise Pseudocercosporella herpotrichoides.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe weisen auch eine starke stärkende Wirkung in Pflanzen auf. Sie eignen sich daher zur Mobilisierung pflanzeneigener Abwehrkräfte gegen Befall durch unerwünschte Mikroorganismen.

Unter pflanzenstärkenden (resistenzinduzierenden) Stoffen sind im vorliegenden Zusammenhang solche Substanzen zu verstehen, die in der Lage sind, das Abwehrsystem von Pflanzen so zu stimulieren, dass die behandelten Pflanzen bei nachfolgender Inokulation mit unerwünschten

35 Mikroorganismen weitgehende Resistenz gegen diese Mikroorganismen entfalten.

15

30

35

Unter unerwünschten Mikroorganismen sind im vorliegenden Fall phytopathogene Pilze, Bakterien und Viren zu verstehen. Die erfindungsgemäßen Stoffe können also eingesetzt werden, um Pflanzen innerhalb eines gewissen Zeitraumes nach der Behandlung gegen den Befall durch die genannten Schaderreger zu schützen. Der Zeitraum, innerhalb dessen Schutz herbeigeführt wird, erstreckt sich im allgemeinen von 1 bis 10 Tage, vorzugsweise 1 bis 7 Tage nach der Behandlung der Pflanzen mit den Wirkstoffen.

Die gute Pflanzenverträglichkeit der Wirkstoffe in den zur Bekämpfung von Pflanzenkrankheiten notwendigen Konzentrationen erlaubt eine Behandlung von oberirdischen Pflanzenteilen, von Pflanzund Saatgut, und des Bodens.

Dabei lassen sich die erfindungsgemäßen Wirkstoffe mit besonders gutem Erfolg zur Bekämpfung von Getreidekrankheiten, wie beispielsweise gegen Puccinia-Arten und von Krankheiten im Wein-, Obst- und Gemüseanbau, wie beispielsweise gegen Botrytis-, Venturia- oder Alternaria-Arten, einsetzen.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich auch zur Steigerung des Ernteertrages. Sie sind außerdem mindertoxisch und weisen eine gute Pflanzenverträglichkeit auf.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können gegebenenfalls in bestimmten Konzentrationen und Aufwandmengen auch als Herbizide, zur Beeinflussung des Pflanzenwachstums, sowie zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen verwendet werden. Sie lassen sich gegebenenfalls auch als Zwischen- und Vorprodukte für die Synthese weiterer Wirkstoffe einsetzen.

Erfindungsgemäß können alle Pflanzen und Pflanzenteile behandelt werden. Unter Pflanzen werden hierbei alle Pflanzen und Pflanzenpopulationen verstanden, wie erwünschte und unerwünschte Wildpflanzen oder Kulturpflanzen (einschließlich natürlich vorkommender Kulturpflanzen). Kulturpflanzen können Pflanzen sein, die durch konventionelle Züchtungs- und Optimierungsmethoden oder durch biotechnologische und gentechnologische Methoden oder Kombinationen dieser Methoden erhalten werden können, einschließlich der transgenen Pflanzen und einschließlich der durch Sortenschutzrechte schützbaren oder nicht schützbaren Pflanzensorten. Unter Pflanzenteilen sollen alle oberirdischen und unterirdischen Teile und Organe der Pflanzen, wie Spross, Blatt, Blüte und Wurzel verstanden werden, wobei beispielhaft Blätter, Nadeln, Stängel, Stämme, Blüten, Fruchtkörper, Früchte und Samen sowie Wurzeln, Knollen und Rhizome aufgeführt werden. Zu den Pflanzenteilen gehört auch Erntegut sowie vegetatives und generatives Vermehrungsmaterial, beispielsweise Stecklinge, Knollen, Rhizome, Ableger und Samen.

10

20

Die erfindungsgemäße Behandlung der Pflanzen und Pflanzenteile mit den Wirkstoffen erfolgt direkt oder durch Einwirkung auf deren Umgebung, Lebensraum oder Lagerraum nach den üblichen Behandlungsmethoden, z.B. durch Tauchen, Sprühen, Verdampfen, Vernebeln, Streuen, Aufstreichen und bei Vermehrungsmaterial, insbesondere bei Samen, weiterhin durch ein- oder mehrschichtiges Umhüllen.

Im Materialschutz lassen sich die erfindungsgemäßen Stoffe zum Schutz von technischen Materialien gegen Befall und Zerstörung durch unerwünschte Mikroorganismen einsetzen.

Unter technischen Materialien sind im vorliegenden Zusammenhang nichtlebende Materialien zu verstehen, die für die Verwendung in der Technik zubereitet worden sind. Beispielsweise können technische Materialien, die durch erfindungsgemäße Wirkstoffe vor mikrobieller Veränderung oder Zerstörung geschützt werden sollen, Klebstoffe, Leime, Papier und Karton, Textilien, Leder, Holz, Anstrichmittel und Kunststoffartikel, Kühlschmierstoffe und andere Materialien sein, die von Mikroorganismen befallen oder zersetzt werden können. Im Rahmen der zu schützenden Materialien seien auch Teile von Produktionsanlagen, beispielsweise Kühlwasserkreisläufe, genannt, die durch Vermehrung von Mikroorganismen beeinträchtigt werden können. Im Rahmen der vorliegenden Erfindung seien als technische Materialien vorzugsweise Klebstoffe, Leime, Papiere und Kartone, Leder, Holz, Anstrichmittel, Kühlschmiermittel und Wärmeübertragungsflüssigkeiten genannt, besonders bevorzugt Holz.

Als Mikroorganismen, die einen Abbau oder eine Veränderung der technischen Materialien bewirken können, seien beispielsweise Bakterien, Pilze, Hefen, Algen und Schleimorganismen genannt. Vorzugsweise wirken die erfindungsgemäßen Wirkstoffe gegen Pilze, insbesondere Schimmelpilze, holzverfärbende und holzzerstörende Pilze (Basidiomyceten) sowie gegen Schleimorganismen und Algen.

Es seien beispielsweise Mikroorganismen der folgenden Gattungen genannt:

Alternaria, wie Alternaria tenuis,

Aspergillus, wie Aspergillus niger,
Chaetomium, wie Chaetomium globosum,
Coniophora, wie Coniophora puetana,
Lentinus, wie Lentinus tigrinus,
Penicillium, wie Penicillium glaucum,

Polyporus, wie Polyporus versicolor,Aureobasidium, wie Aureobasidium pullulans,

15

20

30

35

Sclerophoma, wie Sclerophoma pityophila,
Trichoderma, wie Trichoderma viride,
Escherichia, wie Escherichia coli,
Pseudomonas, wie Pseudomonas aeruginosa,
Staphylococcus, wie Staphylococcus aureus.

Die Wirkstoffe können in Abhängigkeit von ihren jeweiligen physikalischen und/ oder chemischen Eigenschaften in die üblichen Formulierungen überführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Pulver, Schäume, Pasten, Granulate, Aerosole, Feinstverkapselungen in polymeren Stoffen und in Hüllmassen für Saatgut, sowie ULV-Kalt- und Warmnebel-Formulierungen.

Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln, unter Druck stehenden verflüssigten Gasen und/oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln. also Emulgiermitteln und/oder Dispergiermitteln und/oder schaumerzeugenden Mitteln. Im Falle der Benutzung von Wasser als Streckmittel können z.B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel kommen im Wesentlichen infrage: Aromaten, wie Xylol, Toluol oder Alkylnaphthaline, chlorierte Aromaten oder chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzole, Chlorethylene oder Methylenchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine, z.B. Erdölfraktionen, Alkohole, wie Butanol oder Glycol sowie deren Ether und Ester, Ketone, wie Aceton, Methylethylketon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser. Mit verflüssigten gasförmigen Streckmitteln oder Trägerstoffen sind solche Flüssigkeiten gemeint, welche bei normaler Temperatur und unter Normaldruck gasförmig sind, z.B. Aerosol-Treibgase, wie Halogenkohlenwasserstoffe sowie Butan, Propan, Stickstoff und Kohlendioxid. Als feste Trägerstoffe kommen infrage: z.B. natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diatomeenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kieselsäure, Aluminiumoxid und Silikate. Als feste Trägerstoffe für Granulate kommen infrage: z.B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Bims, Marmor, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnussschalen, Maiskolben und Tabakstängel. Als Emulgier und/oder schaumerzeugende Mittel kommen infrage: z.B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäureester, Polyoxyethylen-Fettalkoholether, z.B. Alkylarylpolyglycolether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Eiweißhydrolysate. Als Dispergiermittel kommen infrage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthetische pulverige; körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie Gummiarabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospholipide, wie Kephaline und Lecithine, und synthetische Phospholipide. Weitere Additive können mineralische und vegetabile Öle sein.

5

Es können Farbstoffe wie anorganische Pigmente, z.B. Eisenoxid, Titanoxid, Ferrocyanblau und organische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyaninfarbstoffe und Spurennährstoffe, wie Salze von Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zink verwendet werden.

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gewichtsprozent Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 %.

15

30

35 -

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als solche oder in ihren Formulierungen auch in Mischung mit bekannten Fungiziden, Bakteriziden, Akariziden, Nematiziden oder Insektiziden verwendet werden, um so z.B. das Wirkungsspektrum zu verbreitern oder Resistenzentwicklungen vorzubeugen. In vielen Fällen erhält man dabei synergistische Effekte, d.h. die Wirksamkeit der Mischung ist größer als die Wirksamkeit der Einzelkomponenten.

Als Mischpartner kommen zum Beispiel folgende Verbindungen infrage:

20 Fungizide:

2-Phenylphenol; 8-Hydroxychinolinsulfat; Acibenzolar-S-methyl; Aldimorph; Amidoflumet; Ampropylfos; Ampropylfos-potassium; Andoprim; Anilazine; Azaconazole; Azoxystrobin; Benalaxyl; Benodanil; Benomyl; Benthiavalicarb-isopropyl; Benzamacril; Benzamacril-isobutyl; Bilanafos; Binapacryl; Biphenyl; Bitertanol; Blasticidin-S; Bromuconazole; Bupirimate; Buthiobate; Butylamin; Calcium polysulfide; Capsimycin; Captafol; Captan; Carbendazim; Carboxin; Carpropamid; Carvone; Chinomethionat; Chlobenthiazone; Chlorfenazole; Chloroneb; Chlorothalonil; Chlozolinate; Clozylacon; Cyazofamid; Cyflufenamid; Cymoxanil; Cyproconazole; Cyprodinil; Cyprofuram; Dagger G; Debacarb; Dichlofluanid; Dichlone; Dichlorophen; Diclocymet; Diclomezine; Dicloran; Diethofencarb; Difenoconazole; Diflumetorim; Dimethirimol; Dimethomorph; Dimoxystrobin; Diniconazole; Diniconazole-M; Dinocap; Diphenylamine; Dipyrithione; Ditalimfos; Dithianon; Dodine; Drazoxolon; Edifenphos; Epoxiconazole; Ethaboxam; Ethirimol; Etridiazole; Famoxadone; Fenamidone; Fenapanil; Fenarimol; Fenbuconazole; Fenfuram; Fenhexamid; Fenitropan; Fenoxanil; Fenpiclonil; Fenpropidin; Fenpropimorph; Ferbam; Fluazinam; Flubenzimine; Fludioxonil; Flumetover; Flumorph; Fluoromide; Fluoxastrobin; Fluquinconazole; Flurprimidol; Flusilazole; Flusulfamide; Flutolanil; Flutriafol; Folpet; Fosetyl-Al; Fosetyl-sodium; Fuberidazole; Furalaxyl; Furametpyr; Furcarbanil; Furmecyclox; Guazatine; Hexachlorobenzene; Hexaconazole; Hymexazol; Imaza-

15

20

25

30

35

lil; Imibenconazole; Iminoctadine triacetate; Iminoctadine tris(albesil; Iodocarb; Ipconazole; Iprobenfos; Iprodione; Iprovalicarb; Irumamycin; Isoprothiolane; Isovaledione; Kasugamycin; Kresoxim-methyl; Mancozeb; Maneb; Meferimzone; Mepanipyrim; Mepronil; Metalaxyl; Metalaxyl-M; Metconazole; Methasulfocarb; Methfuroxam; Metiram; Metominostrobin; Metsulfovax; Mildiomycin; Myclobutanil; Myclozolin; Natamycin; Nicobifen; Nitrothal-isopropyl; Noviflumuron; Nuarimol; Ofurace; Orysastrobin; Oxadixyl; Oxolinic acid; Oxpoconazole; Oxycarboxin; Oxyfenthiin; Paclobutrazol; Pefurazoate; Penconazole; Pencycuron; Phosdiphen; Phthalide; Picoxystrobin; Piperalin; Polyoxins; Polyoxorim; Probenazole; Prochloraz; Procymidone; Propamocarb; Propamosinesodium; Propiconazole; Propineb; Proquinazid; Prothioconazole; Pyraclostrobin; Pyrazophos; Pyrifenox; Pyrimethanil; Pyroquilon; Pyroxyfur; Pyrrolnitrine; Quinconazole; Quinoxyfen; Quintozene; Simeconazole; Spiroxamine; Sulfur; Tebuconazole; Tecloftalam; Tecnazene; Tetcyclacis; Tetraconazole; Thiabendazole; Thicyofen; Thifluzamide; Thiophanate-methyl; Thiram; Tioxymid; Tolclofosmethyl; Tolylfluanid; Triadimefon; Triadimenol; Triazbutil; Triazoxide; Tricyclamide; Tricyclazole; Tridemorph; Trifloxystrobin; Triflumizole; Triforine; Triticonazole; Uniconazole; Validamycin A; Vinclozolin; Zineb; Ziram; Zoxamide; (2S)-N-[2-[4-[[3-(4-Chlorphenyl)-2-propinyl]oxy]-3-methoxyphenyl]ethyl]-3-methyl-2-[(methylsulfonyl)amino]-butanamid; 1-(1-Naphthalenyl)-1H-pyrrol-2.5-dion; 2.3.5.6-Tetrachlor-4-(methylsulfonyl)-pyridin; 2-Amino-4-methyl-N-phenyl-5-thiazolcarboxamid; 2-Chlor-N-(2,3-dihydro-1,1,3-trimethyl-1H-inden-4-yl)-3-pyridincarboxamide; 3,4,5-Trichlor-2,6-pyridindicarbonitril; Actinovate; cis-1-(4-Chlorphenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-cycloheptanol; Methyl 1-(2,3-dihydro-2,2-dimethyl-1H-inden-1-yl)-1H-imidazol-5-carboxylat; Monokaliumcarbonat; N-(6-Methoxy-3-pyridinyl)-cyclopropancarboxamid; N-Butyl-8-(1,1-dimethylethyl)-1oxaspiro[4.5]decan-3-amin; Natriumtetrathiocarbonat; sowie Kupfersalze und -zubereitungen, wie Bordeaux mixture; Kupferhydroxid; Kupfernaphthenat; Kupferoxychlorid; Kupfersulfat; Cufraneb; Kupferoxid; Mancopper; Oxine-copper.

Bakterizide:

Bronopol, Dichlorophen, Nitrapyrin, Nickel-dimethyldithiocarbamat, Kasugamycin, Octhilinon, Furancarbonsäure, Oxytetracyclin, Probenazol, Streptomycin, Tecloftalam, Kupfersulfat und andere Kupfer-Zubereitungen.

Insektizide / Akarizide / Nematizide:

Abamectin, ABG-9008, Acephate, Acequinocyl, Acetamiprid, Acetoprole, Acrinathrin, AKD-1022, AKD-3059, AKD-3088, Alanycarb, Aldicarb, Aldoxycarb, Allethrin, Allethrin 1R-isomers, Alpha-Cypermethrin (Alphamethrin), Amidoflumet, Aminocarb, Amitraz, Avermectin, AZ-60541, Azadirachtin, Azamethiphos, Azinphos-methyl, Azinphos-ethyl, Azocyclotin, Bacillus popilliae, Bacillus sphaericus, Bacillus subtilis, Bacillus thuringiensis, Bacillus thuringiensis strain EG-2348, Bacillus

10

15

20

25

30

35

thuringiensis strain GC-91, Bacillus thuringiensis strain NCTC-11821, Baculoviren, Beauveria bassiana, Beauveria tenella, Benclothiaz, Bendiocarb, Benfuracarb, Bensultap, Benzoximate, Beta-Cyfluthrin, Beta-Cypermethrin, Bifenazate, Bifenthrin, Binapacryl, Bioallethrin, Bioallethrin-Scyclopentyl-isomer, Bioethanomethrin, Biopermethrin, Bioresmethrin, Bistrifluron, BPMC, Brofenprox, Bromophos-ethyl, Bromopropylate, Bromfenvinfos (-methyl), BTG-504, BTG-505, Bufencarb, Buprofezin, Butathiofos, Butocarboxim, Butoxycarboxim, Butylpyridaben, Cadusafos, Camphechlor, Carbaryl, Carbofuran, Carbophenothion, Carbosulfan, Cartap, CGA-50439, Chinomethionat, Chlordane, Chlordimeform, Chloethocarb, Chlorethoxyfos, Chlorfenapyr, Chlorfenvinphos, Chlorfluazuron, Chlormephos, Chlorobenzilate, Chloropicrin, Chlorproxyfen, Chlorpyrifos-methyl, Chlorpyrifos (-ethyl), Chlovaporthrin, Chromafenozide, Cis-Cypermethrin, Cis-Resmethrin, Cis-Permethrin, Clocythrin, Cloethocarb, Clofentezine, Clothianidin, Clothiazoben, Codlemone, Coumaphos, Cyanofenphos, Cyanophos, Cycloprene, Cycloprothrin, Cydia pomonella, Cyfluthrin, Cyhalothrin, Cyhexatin, Cypermethrin, Cyphenothrin (1R-trans-isomer), Cyromazine, DDT, Deltamethrin, Demeton-Smethyl; Demeton-S-methylsulphon, Diafenthiuron, Dialifos, Diazinon, Dichlofenthion, Dichlorvos, Dicofol, Dicrotophos, Dicyclanil, Diflubenzuron, Dimefluthrin, Dimethoate, Dimethylvinphos, Dinobuton, Dinocap, Dinotefuran, Diofenolan, Disulfoton, Docusat-sodium, Dofenapyn, DOWCO-439, Eflusilanate, Emamectin, Emamectin-benzoate, Empenthrin (1R-isomer), Endosulfan, Entomopthora spp., EPN, Esfenvalerate, Ethiofencarb, Ethiprole, Ethion, Ethoprophos, Etofenprox, Etoxazole, Etrimfos, Famphur, Fenamiphos, Fenazaquin, Fenbutatin oxide, Fenfluthrin, Fenitrothion, Fenobucarb, Fenothiocarb, Fenoxacrim, Fenoxycarb, Fenpropathrin, Fenpyrad, Fenpyrithrin, Fenpyroximate, Fensulfothion, Fenthion, Fentrifanil, Fenvalerate, Fipronil, Flonicamid, Fluacrypyrim, Fluazuron, Flubenzimine, Flubrocythrinate, Flucycloxuron, Flucythrinate, Flufenerim, Flufenoxuron, Flufenprox, Flumethrin, Flupyrazofos, Flutenzin (Flufenzine), Fluvalinate, Fonofos, Formetanate, Formothion, Fosmethilan, Fosthiazate, Fubfenprox (Fluproxyfen), Furathiocarb, Gamma-Cyhalothrin, Gamma-HCH, Gossyplure, Grandlure, Granuloseviren, Halfenprox, Halofenozide, HCH, HCN-801, Heptenophos, Hexaflumuron, Hexythiazox, Hydramethylnone, Hydroprene, IKA-2002, Imidacloprid, Imiprothrin, Indoxacarb, Iodofenphos, Iprobenfos, Isazofos, Isofenphos, Isoprocarb, Isoxathion, Ivermectin, Japonilure, Kadethrin, Kernpolyederviren, Kinoprene, Lambda-Cyhalothrin, Lindane, Lufenuron, Malathion, Mecarbam, Mesulfenfos, Metaldehyd, Metam-sodium, Methacrifos, Methamidophos, Metharhizium anisopliae, Metharhizium flavoviride, Methidathion, Methiocarb, Methomyl, Methoprene, Methoxychlor, Methoxyfenozide, Metofluthrin, Metolcarb, Metoxadiazone, Mevinphos, Milbemectin, Milbemycin, MKI-245, MON-45700, Monocrotophos, Moxidectin, MTI-800, Naled, NC-104, NC-170, NC-184, NC-194, NC-196, Niclosamide, Nicotine, Nitenpyram, Nithiazine, NNI-0001, NNI-0101, NNI-0250, NNI-9768, Novaluron, Noviflumuron, OK-5101, OK-5201, OK-9601, OK-9602, OK-9701, OK-9802, Omethoate, Oxamyl, Oxydemeton-methyl, Paecilomyces fumosoroseus, Parathion-methyl, Parathion (-ethyl), Permethrin (cis-, trans-), Petroleum, PH-

6045, Phenothrin (1R-trans isomer), Phenthoate, Phorate, Phosalone, Phosmet, Phosphamidon, Phosphocarb, Phoxim, Piperonyl butoxide, Pirimicarb, Pirimiphos-methyl, Pirimiphos-ethyl, Potassium oleate, Prallethrin, Profenofos, Profluthrin, Promecarb, Propaphos, Propargite, Propetamphos, Propoxur, Prothiofos, Prothoate, Protrifenbute, Pymetrozine, Pyraclofos, Pyresmethrin, Pyrethrum, Pyridaben, Pyridalyl, Pyridaphenthion, Pyridathion, Pyrimidifen, Pyriproxyfen, Quinalphos, Resmethrin, RH-5849, Ribavirin, RU-12457, RU-15525, S-421, S-1833, Salithion, Sebufos, SI-0009, Silafluofen, Spirodiclofen, Spiromesifen, Sulfluramid, Sulfotep, Sulprofos, SZI-121, Tau-Fluvalinate, Tebufenozide, Tebufenpyrad, Tebupirimfos, Teflubenzuron, Tefluthrin, Temephos, Temivinphos, Terbam, Terbufos, Tetrachlorvinphos, Tetradifon, Tetramethrin, Tetramethrin (1R-isomer), Tetrasul, Theta-Cypermethrin, Thiacloprid, Thiamethoxam, Thiapronil, Thiatriphos, Thiocyclam hydrogen oxalate, Thiodicarb, Thiofanox, Thiometon, Thiosultap-sodium, Thuringiensin, Tolfenpyrad, Tralocythrin, Tralomethrin, Transfluthrin, Triarathene, Triazamate, Triazophos, Triazuron, Trichlophenidine, Trichlorfon, Trichoderma atroviride, Triflumuron, Trimethacarb, Vamidothion, Vaniliprole, Verbutin, Verticillium lecanii, WL-108477, WL-40027, YI-5201, YI-5301, YI-5302, XMC, Xylylcarb, ZA-3274, Zeta-Cypermethrin, Zolaprofos, ZXI-8901, die Verbindung 3-Methyl-phenylpropylcarbamat (Tsumacide Z), die Verbindung 3-(5-Chlor-3-pyridinyl)-8-(2,2,2-trifluorethyl)-8azabicyclo[3.2.1]octan-3-carbonitril (CAS-Reg.-Nr. 185982-80-3) und das entsprechende 3-endo-Isomere (CAS-Reg.-Nr. 185984-60-5) (vgl. WO 96/37494, WO 98/25923), sowie Präparate, welche insektizid wirksame Pflanzenextrakte, Nematoden, Pilze oder Viren enthalten.

20

5

10

15

Auch eine Mischung mit anderen bekannten Wirkstoffen, wie Herbiziden oder mit Düngemitteln und Wachstumsregulatoren, Safener bzw. Semiochemicals ist möglich.

25

30

35

Darüber hinaus weisen die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) auch sehr gute antimykotische Wirkungen auf. Sie besitzen ein sehr breites antimykotisches Wirkungsspektrum, insbesondere gegen Dermatophyten und Sprosspilze, Schimmel und diphasische Pilze (z.B. gegen Candida-Spezies wie Candida albicans, Candida glabrata) sowie Epidermophyton floccosum, Aspergillus-Spezies wie Aspergillus niger und Aspergillus furnigatus, Trichophyton-Spezies wie Trichophyton mentagrophytes, Microsporon-Spezies wie Microsporon canis und audouinii. Die Aufzählung dieser Pilze stellt keinesfalls eine Beschränkung des erfassbaren mykotischen Spektrums dar, sondern hat nur erläuternden Charakter.

Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus bereiteten Anwendungsformen, wie gebrauchsfertige Lösungen, Suspensionen, Spritzpulver, Pasten, lösliche Pulver, Stäubemittel und Granulate angewendet werden. Die Anwendung geschieht in üblicher Weise, z.B. durch Gießen, Verspritzen, Versprühen, Verstreuen, Verstäuben, Verschäumen, Bestrei-

20.

30

35

chen usw. Es ist ferner möglich, die Wirkstoffe nach dem Ultra-Low-Volume-Verfahren auszubringen oder die Wirkstoffzubereitung oder den Wirkstoff selbst in den Boden zu injizieren. Es kann auch das Saatgut der Pflanzen behandelt werden.

Beim Einsatz der erfindungsgemäßen Wirkstoffe als Fungizide können die Aufwandmengen je nach Applikationsart innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Bei der Behandlung von Pflanzenteilen liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,1 und 10.000 g/ha, vorzugsweise zwischen 10 und 1.000 g/ha. Bei der Saatgutbehandlung liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,001 und 50 g pro Kilogramm Saatgut, vorzugsweise zwischen 0,01 und 10 g pro Kilogramm Saatgut. Bei der Behandlung des Bodens liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,1 und 10.000 g/ha, vorzugsweise zwischen 1 und 5.000 g/ha.

Wie bereits oben erwähnt, können erfindungsgemäß alle Pflanzen und deren Teile behandelt werden. In einer bevorzugten Ausführungsform werden wild vorkommende oder durch konventionelle biologische Zuchtmethoden, wie Kreuzung oder Protoplastenfusion erhaltenen Pflanzenarten und Pflanzensorten sowie deren Teile behandelt. In einer weiteren bevorzugten Ausführungsform werden transgene Pflanzen und Pflanzensorten, die durch gentechnologische Methoden gegebenenfalls in Kombination mit konventionellen Methoden erhalten wurden (Genetically Modified Organisms) und deren Teile behandelt. Der Begriff "Teile" bzw. "Teile von Pflanzen" oder "Pflanzenteile" wurde oben erläutert.

Besonders bevorzugt werden erfindungsgemäß Pflanzen der jeweils handelsüblichen oder in Gebrauch befindlichen Pflanzensorten behandelt. Unter Pflanzensorten versteht man Pflanzen mit neuen Eigenschaften ("Traits"), die sowohl durch konventionelle Züchtung, durch Mutagenese oder durch rekombinante DNA-Techniken gezüchtet worden sind. Dies können Sorten, Rassen, Bio- und Genotypen sein.

Je nach Pflanzenarten bzw. Pflanzensorten, deren Standort und Wachstumsbedingungen (Böden, Klima, Vegetationsperiode, Ernährung) können durch die erfindungsgemäße Behandlung auch überadditive ("synergistische") Effekte auftreten. So sind beispielsweise erniedrigte Aufwandmengen und/oder Erweiterungen des Wirkungsspektrums und/oder eine Verstärkung der Wirkung der erfindungsgemäß verwendbaren Stoffe und Mittel, besseres Pflanzenwachstum, erhöhte Toleranz gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz gegen Trockenheit oder gegen Wasser- bzw. Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, erleichterte Ernte, Beschleunigung der Reife, höhere Ernteerträge, höhere Qualität und/oder höherer Ernährungswert der Ernteprodukte, höhere

15

20

30

Lagerfähigkeit und/oder Bearbeitbarkeit der Ernteprodukte möglich, die über die eigentlich zu erwartenden Effekte hinausgehen.

Zu den bevorzugten erfindungsgemäß zu behandelnden transgenen (gentechnologisch erhaltenen) Pflanzen bzw. Pflanzensorten gehören alle Pflanzen, die durch die gentechnologische Modifikation genetisches Material erhielten, welches diesen Pflanzen besondere vorteilhafte wertvolle Eigenschaften ("Traits") verleiht. Beispiele für solche Eigenschaften sind besseres Pflanzenwachstum, erhöhte Toleranz gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz gegen Trockenheit oder gegen Wasser- bzw. Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, erleichterte Ernte, Beschleunigung der Reife, höhere Ernteerträge, höhere Qualität und/oder höherer Ernährungswert der Ernteprodukte, höhere Lagerfähigkeit und/oder Bearbeitbarkeit der Ernteprodukte. Weitere und besonders hervorgehobene Beispiele für solche Eigenschaften sind eine erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen tierische und mikrobielle Schädlinge, wie gegenüber Insekten, Milben, pflanzenpathogenen Pilzen, Bakterien und/oder Viren sowie eine erhöhte Toleranz der Pflanzen gegen bestimmte herbizide Wirkstoffe. Als Beispiele transgener Pflanzen werden die wichtigen Kulturpflanzen, wie Getreide (Weizen, Reis), Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle, Tabak, Raps sowie Obstpflanzen (mit den Früchten Äpfel, Birnen, Zitrusfrüchten und Weintrauben) erwähnt, wobei Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle, Tabak und Raps besonders hervorgehoben werden. Als Eigenschaften ("Traits") werden besonders hervorgehoben die erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen Insekten, Spinnentiere, Nematoden und Schnecken durch in den Pflanzen entstehende Toxine, insbesondere solche, die durch das genetische Material aus Bacillus thuringiensis (z.B. durch die Gene CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c Cry2Ab, Cry3Bb und CryIF sowie deren Kombinationen) in den Pflanzen erzeugt werden (im Folgenden "Bt Pflanzen"). Als Eigenschaften ("Traits") werden auch besonders hervorgehoben die erhöhte Abwehr von Pflanzen gegen Pilze, Bakterien und Viren durch Systemische Akquirierte Resistenz (SAR), Systemin, Phytoalexine, Elicitoren sowie Resistenzgene und entsprechend exprimierte Proteine und Toxine. Als Eigenschaften ("Traits") werden weiterhin besonders hervorgehoben die erhöhte Toleranz der Pflanzen gegenüber bestimmten herbiziden Wirkstoffen, z.B. Imidazolinonen, Sulfonylharnstoffen, Glyphosate oder Phosphinotricin (z.B. "PAT"-Gen). Die jeweils die gewünschten Eigenschaften ("Traits") verleihenden Gene können auch in Kombinationen miteinander in den transgenen Pflanzen vorkommen. Als Beispiele für "Bt Pflanzen" seien Maissorten, Baumwollsorten, Sojasorten und Kartoffelsorten genannt, die unter den Handelsbezeichnungen YIELD GARD® (z.B. Mais, Baumwolle, Soja), KnockOut® (z.B. Mais), StarLink® (z.B. Mais), Bollgard® (Baumwolle), Nucoton® (Baumwolle) und NewLeaf® (Kartoffel) vertrieben werden. Als Beispiele für Herbizid tolerante Pflanzen seien Maissorten, Baumwollsorten und Sojasorten genannt, die unter den Handelsbezeichnungen Roundup Ready® (Toleranz gegen Glyphosate z.B. Mais, Baumwolle, Soja), Liberty Link® (Toleranz gegen Phosphinotricin, z.B.

15

Raps), IMI® (Toleranz gegen Imidazolinone) und STS® (Toleranz gegen Sulfonylharnstoffe z.B. Mais) vertrieben werden. Als Herbizid resistente (konventionell auf Herbizid-Toleranz gezüchtete) Pflanzen seien auch die unter der Bezeichnung Clearfield® vertriebenen Sorten (z.B. Mais) erwähnt. Selbstverständlich gelten diese Aussagen auch für in der Zukunft entwickelte bzw. zukünftig auf den Markt kommende Pflanzensorten mit diesen oder zukünftig entwickelten genetischen Eigenschaften ("Traits").

Die aufgeführten Pflanzen können besonders vorteilhaft erfindungsgemäß mit den Verbindungen der allgemeinen Formel (I) bzw. den erfindungsgemäßen Wirkstoffmischungen behandelt werden. Die bei den Wirkstoffen bzw. Mischungen oben angegebenen Vorzugsbereiche gelten auch für die Behandlung dieser Pflanzen. Besonders hervorgehoben sei die Pflanzenbehandlung mit den im vorliegenden Text speziell aufgeführten Verbindungen bzw. Mischungen.

Die Herstellung und die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe geht aus den folgenden Beispielen hervor.

Herstellungsbeispiele

Beispiel 1

Zu einer Lösung bestehend aus 388.5 mg (2.2 mmol) 5-Fluor-1,3-dimethyl-1H-pyrazol-4-carbonyl-chlorid und 0.45 ml (3.2 mmol) Triethylamin in 20 ml Tetrahydrofuran werden 326.5 mg (2.0 mmol) [2-(3-Methylbutyl)phenyl]amin (III-1) gegeben. Die Reaktionslösung wird 90 min. bei 60°C gerührt, über Kieselgel filtriert und aufkonzentriert. Säulenchromatographie (Gradient Cyclohexan/Essigsäureethylester) liefert 592 mg (98 % der Theorie) an 5-Fluor-1,3-dimethyl-N-[2-(3-methylbutyl)phenyl]-1H-pyrazol-4-carboxamid mit dem logP (pH 2.3) = 3.12.

Analog Beispiel 1 sowie entsprechend den Angaben in den allgemeinen Verfahrensbeschreibungen, werden die in der nachstehenden Tabelle 1 genannten Verbindungen der Formel (I) erhalten.

15 Tabelle 1

$$\begin{array}{c|c}
O & & & \\
R^1 & & & \\
R^3 & & & \\
H_3C & & CH_3
\end{array}$$
(I)

Bsp.	R ¹	R ²	R ³	· A	logP
2	H	Н	CḢ́₃	H ₃ C N N CH ₃	3.42
3	н	H	CH₃	H ₃ C	.4.14
4	Н	Н	Н	CF ₃	3.90

Bsp.	R ¹	R ²	R³	Α	logP
5	н	Ħ	СН₃	CF ₃	4.13
6	Н	Н	Н		3.87
.7	н	Н	СН₃		4.15
8	. Н	Н	н .	Bi-	3.78
9	Н	. Н	Н	<u>-</u>	3.76
10	н	. Н	Н	F ₃ C N N CH ₃	3.68
11	Н	н	СН₃	F ₂ HC.	3.28
12	Н	Н	CH₃	F ₃ C N N CH ₃	3.91
13	Н	4-Cl	C ₂ H ₅	CF ₃	4.96
14	H	4-CI	C₂H₅		5.02

Herstellung von Ausgangsstoffen der Formel (III)

Beispiel (III-1)

Eine Lösung bestehend aus 8.0 g (0.045 mol) 1-(2-Amino-phenyl)-3-methyl-butan-1-on (X-1), 6.8 g (0.135 mol) Hydrazin-hydrat und 7.6 g (0.135 mol) Kaliumhydroxid in 90 ml Triethylenglycol wird für 6 h auf 210°C erhitzt. Zur Aufarbeitung wird bei Raumtemperatur Wasser und Essigsäureethylester zugegeben. Die organische Phase wird erneut mit Wasser gewaschen, über Magnesiumsulfat getrocknet und unter vermindertem Druck aufkonzentriert. Reinigung durch Säulenchromatographie (Cyclohexan/Essigsäureethylester 3:1) liefert 5.3 g (71.5 % der Theorie) an [2-(3-Methylbutyl)-phenyl]amin.

Beispiel (III-2)

3.23 g (15 mmol) N-[2-(3,3-Dimethyl-but-1-inyl)-phenyl]-acetamid (XIII-1) wurden in 40 ml Methanol vorgelegt. Man gibt 0.5 g Palladium-Kohle (5 %) zu und hydriert anschließend im Autoklaven 20 h bei 4 bar Wasserstoffdruck. Nach Abtrennung des Katalysators und Entfernung des Lösungsmittels erhielt man 3.1 g (94 % der Theorie) an N-[2-(3,3-Dimethyl-butyl)-phenyl]-acetamid mit dem logP (pH 2.3) = 2.69.

Beispiel (III-3)

20

0.5 g (2.3 mmol) N-[2-(3,3-Dimethyl-butyl)-phenyl]-acetamid (III-2) wurden in 20 ml 2N Salzsäure 5 h bei 100°C gerührt. Nach dem Abkühlen wurde 3 mal mit je 20 ml Essigsäureethylester extrahiert. Die organische Phase wurde abgetrennt, über Natriumsulfat getrocknet und eingeengt. Man erhielt 390 mg (79 % der Theorie) an 2-(3,3-Dimethyl-butyl)-phenylamin-Hydrochlorid mit dem logP (pH 2.3) = 2.20.

Herstellung von Ausgangsstoffen der Formel (V)

Beispiel (V-1)

5

10

15

Bei Raumtemperatur werden 355.0 mg (2.0 mmol) 1-(2-Amino-phenyl)-3-methyl-butan-1-on zu einer Lösung bestehend aus 388.5 mg (2.2 mmol) 5-Fluor-1,3-dimethyl-1H-pyrazol-4-carbonyl-chlorid und 0.45 ml (3.2 mmol) Triethylamin in 20 ml Tetrahydrofuran gegeben. Die Reaktionsmischung wird für 1.5 h bei 60°C gerührt, über Kieselgel filtriert und aufkonzentriert. Säulenchromatographie (Cyclohexan/Essigester : 3/1) liefert 577.7 mg (1.8 mmol, 88 % der Theorie) an 5-Fluor-1,3-dimethyl-1H-pyrazol-4-carbonsäure-[2-(3-methyl-butyryl)-phenyl]-amid mit dem logP (pH = 2.3) = 3.42.

Analog Beispiel (V-1) sowie entsprechend den Angaben in den allgemeinen Verfahrensbeschreibungen, werden die in der nachstehenden Tabelle 2 genannten Verbindungen der Formel (V) erhalten.

Tabelle 2

$$\begin{array}{c|c}
O & & & \\
R^1 & & & \\
R^1 & & & \\
R^3 & & \\
CH_3 & & &
\end{array}$$
(V)

Bsp.	R¹	R ²	R ³	Α .	logP
V-2	н	Н	н.	H ₃ C	4.30

Bsp.	R ¹	R ²	R^3	A	logP
V-3	Н .	Н	H	CF ₃	4.33
V-4	Н	Н	Н		4.53
V-5	Н	_. H	Н	Br	4.35
V-6	Н	н	Н	C	4.30
V-7	Н	Н	H .	. CH ₃	4,44

Herstellung von Ausgangsstoffen der Formel (VII)

Beispiel (VII-1)

190 mg (1.0 mmol) 2-Trifluormethylbenzoesäure, 178 mg (0.83 mmol) 2-(3,3-Dimethyl-but-1-inyl)phenylamin, 215 mg (1.67 mmol) N,N-Diisopropylethylamin und 583 mg (1.25 mmol) PyBrOP
wurden in 8 ml Acetonitril 4 Tage bei Raumtemperatur gerührt. Das Gemisch wurde mit 10 ml
Essigsäureethylester/Wasser 1:1 versetzt, die organische Phase abgetrennt und mit 10 ml gesättigter
Ammoniumchlorid-Lösung und anschließend mit 10 ml Wasser gewaschen. Abtrennen, Einengen
und Trocknen der organischen Phase lieferte 950 mg Rohprodukt. Nach säulenchromatographischer
Reinigung über Kieselgel 60 (Petrolether/Essigsäureethylester 10:1 → Essigsäureethylester) wurden
110 mg N-[2-(3,3-Dimethyl-but-1-inyl)-phenyl]-2-trifluoromethyl-benzamid erhalten [logP (pH 2.3)

10

Analog Beispiel (VII-1) sowie entsprechend den Angaben in den allgemeinen Verfahrensbeschreibungen, werden die in der nachstehenden Tabelle 3 genannten Verbindungen der Formel (VII) erhalten.

5 Tabelle 3

Bsp.	R ¹	R²	R³	Α	logP
VII-2	Н	Н .	СН₃		4.73
VII-3	H	Н	CH₃	CI	3.75
VII-4	H	Н	CH₃	CH₃	4.52
VII-5	н	Н	CH₃	F ₂ HC N S CH ₃	4.17

Herstellung von Ausgangsstoffen der Formel (X)

Beispiel (X-1)

10

15

Eine Lösung aus 29.5 g (0.25 mol) Antranilsäurenitril in 150 ml Tetrahydrofuran wird bei Rückfluss zu einer Suspension bestehend aus 18.2 g (0.75 mol) Magnesium, 375 ml einer 2 M Lösung von Isobutylmagnesiumbromid in Tetrahydrofuran und 15 ml Diethylether getropft. Nach 5 h Erhitzen

unter Rückfluss wird die Reaktionsmischung bei 0°C mit 100 ml Wasser versetzt, und der pH-Wert mit Salzsäure auf 6 eingestellt. Die organische Phase wird mit Wasser gewaschen und über Magnesiumsulfat getrocknet. Aufkonzentration im Vakuum und Reinigung an Kieselgel (Eluent: Petrolether/Aceton 95:5) liefert 11.0 g (25 % der Theorie) an 1-(2-Amino-phenyl)-3-methyl-butan-1-on mit dem logP (pH 2.3) = 2.89...

Herstellung von Ausgangsstoffen der Formel (XIII)

Beispiel (XIII-1)

5

10

15

25.7 g (120 mmol) ortho-Bromacetanilid, 5.05 g (7.2 mmol) Bis(triphenylphosphin)palladium(II)chlorid und 1.37 g (7.2 mmol) Kupfer(I)iodid wurden in 450 ml Triethylamin unter Argon vorgelegt. Anschließend wurde bei Raumtemperatur innerhalb von 10 min. 17.8 g (180 mmol) 3,3-Dimethyl-1-butin zugetropft und 5 h bei 50°C gerührt. Die Reaktionsmischung wurde auf 2 l Wasser gegossen, 3 mal mit je 250 ml Diethylether extrahiert, über Natriumsulfat getrocknet und eingeengt. Nach säulenchromatographischer Reinigung über Kieselgel 60 mit Methylenchlorid erhält man 25.9 g an N-[2-(3,3-Dimethyl-but-1-inyl)-phenyl]-acetamid mit dem logP (pH 2.3) = 3.03.

Die Bestimmung der in den voranstehenden Tabellen und Herstellungsbeispielen angegebenen logP-Werte erfolgt gemäß EEC-Directive 79/831 Annex V.A8 durch HPLC (High Performance Liquid Chromatography) an einer Phasenumkehrsäule (C 18). Temperatur: 43°C.

Die Bestimmung erfolgt im sauren Bereich bei pH 2.3 mit 0,1 % wässriger Phosphorsäure und Acetonitril als Eluenten; linearer Gradient von 10 % Acetonitril bis 90 % Acetonitril.

Die Eichung erfolgt mit unverzweigten Alkan-2-onen (mit 3 bis 16 Kohlenstoffatomen), deren logP-Werte bekannt sind (Bestimmung der logP-Werte anhand der Retentionszeiten durch lineare Interpolation zwischen zwei aufeinanderfolgenden Alkanonen).

Die lambda-max-Werte wurden an Hand der UV-Spektren von 200 nm bis 400 nm in den Maxima der chromatographischen Signale ermittelt.

Anwendungsbeispiele:

Beispiel A

5 Podosphaera-Test (Apfel) / protektiv

Lösungsmittel:

24,5 Gewichtsteile Aceton

24,5 Gewichtsteile Dimethylacetamid

Emulgator:

1 Gewichtsteil Alkyl-Aryl-Polyglykolether

10

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

2 Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer wässrigen Sporensuspension des Apfelmehltauerregers Podosphaera leucotricha inokuliert. Die Pflanzen werden dann im Gewächshaus bei ca. 23°C und einer relativen Luftfeuchtigkeit von ca. 70 % aufgestellt.

20.

10 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

<u>Tabelle A</u>

Podosphaera-Test (Apfel) / protektiv

Wirkstoff Erfindungsgemäß	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
H ₃ C O H ₃ C CH ₃	100	100
H ₃ C O CH ₃ CH ₃	100	100
H ₃ C O CH ₃ CH ₃	100	99
H ₃ C CH ₃ CH ₃	100	97

Beispiel B

Venturia - Test (Apfel) / protektiv

5 Lösungsmittel:

24,5 Gewichtsteile Aceton

24,5 Gewichtsteile Dimethylacetamid

Emulgator:

15 ·

1 Gewichtsteil Alkyl-Aryl-Polyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff
mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit
Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer wässrigen Konidiensuspension des Apfelschorferregers Venturia inaequalis inokuliert und verbleiben dann 1 Tag bei ca. 20°C und 100 % relativer Luftfeuchtigkeit in einer Inkubationskabine.

Die Pflanzen werden dann im Gewächshaus bei ca. 21°C und einer relativen Luftfeuchtigkeit von ca. 90 % aufgestellt.

<u>Tabelle B</u>

Venturia - Test (Apfel) / protektiv

Wirkstoff Erfindungsgemäß	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
H ₃ C O N H ₃ C CH ₃	100	96
H ₃ C O CH ₃ CH ₃ CH ₃	100	100 ·
H ₃ C O N CH ₃ CH ₃	100	99
H ₃ C CH ₃ CH ₃	100	97

Beispiel C

15

20

Botrytis - Test (Bohne) / protektiv

5 Lösungsmittel: 24,5 Gewichtsteile Aceton

24,5 Gewichtsteile Dimethylacetamid

Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkyl-Aryl-Polyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff
mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit
Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden auf jedes Blatt 2 kleine mit Botrytis einerea bewachsene Agarstücken aufgelegt. Die inokulierten Pflanzen werden in einer abgedunkelten Kammer bei ca. 20°C und 100 % relativer Luftfeuchtigkeit aufgestellt.

2 Tage nach der Inokulation wird die Größe der Befallsflecken auf den Blättern ausgewertet. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

<u>Tabelle C</u>
Botrytis - Test (Bohne) / protektiv

Wirkstoff Erfindungsgemäß	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
H ₃ C O N H ₃ C CH ₃	500	. 84
H ₃ C O N CH ₃	500	100
H ₃ C O CH ₃ CH ₃	500	100
CH ₃	500	87

Beispiel D

10

15

Puccinia-Test (Weizen) / kurativ

5 Lösungsmittel: 50 Gewichtsteile N,N-Dimethylacetamid

Emulgator: 1 Gewichtsteile Alkylarylpolyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Zur Prüfung auf kurative Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit einer Konidiensuspension von Puccinia recondita besprüht. Die Pflanzen verbleiben 48 Stunden bei 20°C und 100 % relativer Luftfeuchtigkeit in einer Inkubationskabine. Anschließend werden die Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht.

Die Pflanzen werden dann in einem Gewächshaus bei einer Temperatur von ca. 20°C und einer relativen Luftfeuchtigkeit von 80 % aufgestellt, um die Entwicklung von Rostpusteln zu begünstigen.

8 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

Tabelle D
Puccinia-Test (Weizen) / kurativ

Wirkstoff Erfindungsgemäß	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
H ₃ C O N H ₃ C CH ₃	500	100
H ₃ C O CH ₃ CH ₃	500	100
H ₃ C O CH ₃ CH ₃	500	100
CF ₃ O N H ₃ C CH ₃	500	100
H ₃ C CH ₃	500	100

Beispiel E

Sphaerotheca-Test (Gurke) / protektiv

5 Lösungsmittel: 49 Gewichtsteile N, N-Dimethylformamid

Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit bespritzt man junge Gurkenpflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge. 1 Tag nach der Behandlung werden die Pflanzen mit einer Sporensuspension von Sphaerotheca fuliginea inokuliert. Anschließend werden die Pflanzen in einem Gewächshaus bei 70 % relativer Luftfeuchtigkeit und einer Temperatur von 23°C aufgestellt.

7 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

10

15

 $\frac{\text{Tabelle E}}{\text{Sphaerotheca-Test (Gurke) / protektiv}}$

Wirkstoff Erfindungsgemäß	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
H ₃ C O N H ₃ C CH ₃	750	100
H ₃ C O CH ₃ CH ₃	750	100
CF ₃ O N H ₃ C CH ₃	750	100
H ₃ C CH ₃ CH ₃	750	100

Patentansprüche

1. Isopentylcarboxanilide der Formel (I)

in welcher

5

10

15

20

25

L für
$$\mathbb{R}^2$$
 \mathbb{R}^2 \mathbb{R}^3 \mathbb{R}^3 \mathbb{R}^3 steht,

wobei die mit * markierte Bindung mit dem Amid verbunden ist, während die mit # markierte Bindung mit der Alkylseitenkette verknüpft ist,

R¹ für Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl; C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₄-Halogenalkylsulfonyl, Halogen-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlorund/oder Bromatomen; Formyl, Formyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-Alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl; Halogen-(C₁-C₃-alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, Halogen-(C₁-C₃-alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen;

(C₁-C₈-Alkyl)carbonyl, (C₁-C₈-Alkoxy)carbonyl, (C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl)carbonyl, (C₃-C₈-Cycloalkyl)carbonyl; (C₁-C₆-Halogenalkyl)carbonyl, (C₁-C₆-Halogenalk-oxy)carbonyl, (Halogen-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl)carbonyl, (C₃-C₈-Halogen-cycloalkyl)carbonyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; oder -C(=O)C(=O)R⁴, -CONR⁵R⁶ oder -CH₂NR⁷R⁸ steht,

R² für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Methyl oder Trifluormethyl steht,

 R^3 für Wasserstoff, Halogen, C_1 - C_8 -Alkyl, C_1 - C_8 -Halogenalkyl steht,

R⁴ für Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Alkoxy, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl; C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Halogenalkoxy, Halogen-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen steht,

10

15

20. .

25

30

- R⁵ und R⁶ unabhängig voneinander jeweils für Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl; C₁-C₈-Halogenalkyl, Halogen-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen stehen,
- R⁵ und R⁶ außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C₁-C₄-Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 bis 8 Ringatomen bilden, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR⁹ enthalten kann,
- R⁷ und R⁸ unabhängig voneinander für Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl; C₁-C₈-Halogenalkyl, C₃-C₈-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlorund/oder Bromatomen stehen,
- R⁷ und R⁸ außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C₁-C₄-Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 bis 8 Ringatomen bilden, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR⁹ enthalten kann,
- R⁹ für Wasserstoff oder C₁-C₆-Alkyl steht,

A für den Rest der Formel (A1)

- R¹⁰ für Wasserstoff, Hydroxy, Formyl, Cyano, Halogen, Nitro, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkylthio mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen, Aminocarbonyl oder Aminocarbonyl-C₁-C₄-alkyl steht,
- R¹¹ für Wasserstoff, Halogen, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkyl oder C₁-C₄-Halogenalkylthio mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen, steht und
- R¹² für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, Hydroxy-C₁-C₄-alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₄-Alkylthio-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Halogenalkylthio-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy-C₁-C₄-alkyl mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen, oder für Phenyl steht,

mit der Maßgabe, dass R^{10} nicht für Iod steht, wenn R^{11} für Wasserstoff steht, und mit der Maßgabe, dass R^{10} nicht für Trifluormethyl oder Difluormethyl steht, wenn R^3 und R^{11} für Wasserstoff und R^{12} für Methyl stehen,

oder

5

10

15

20

25

A für den Rest der Formel (A2)

(A2) steht, in welcher

R¹³ und R¹⁴ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen stehen und

R¹⁵ für Halogen, Cyano oder C₁-C₄-Alkyl, oder C₁-C₄-Halogenalkyl oder C₁-C₄-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A3)

(A3) steht, in welcher

R¹⁶ und R¹⁷ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen stehen und

R¹⁸ für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A4)



(A4) steht, in welcher

R¹⁹ für Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy oder C₁-C₄-Halogenalkylthio mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A5)

(A5) steht, in welcher

R²⁰ für Halogen, Hydroxy, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkylthio oder C₁-C₄-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen steht und

R²¹ für Wasserstoff, Halogen, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen, C₁-C₄-Alkylsulfinyl oder C₁-C₄-Alkylsulfonyl steht,

oder

oder

oder

A für den Rest der Formel (A6)

10 oder-

5

15 .

20

25

A für den Rest der Formel (A7)

R²² für C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

A für den Rest der Formel (A8)

R²³ für C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

A für den Rest der Formel (A9)

R²⁴ und R²⁵ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Amino, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht und

R²⁶ für Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 to 5 Halogenatomen steht,

mit der Maßgabe, dass R²⁴ und R²⁶ nicht gleichzeitig für Methyl stehen, wenn R²⁵ für Wasserstoff steht,

oder

A für den Rest der Formel (A10)

(A10) steht, in welcher

R²⁷ und R²⁸ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Amino, Nitro, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen stehen und
 R²⁹ für Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A11)

(A11) steht, in welcher

R³⁰ für Wasserstoff, Halogen, Amino, C₁-C₄-Alkylamino, Di-(C₁-C₄-alkyl)-amino, Cyano, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht und

R³¹ für Halogen, Hydroxy, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl oder C₁-C₄-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen steht,

mit der Maßgabe, dass R³¹ nicht für Trifluormethyl, Difluormethyl oder Methyl steht, wenn R³ für Wasserstoff und R³⁰ für Methyl stehen,

oder

A für den Rest der Formel (A12)

(A12) steht, in welcher

R³² für Wasserstoff, Halogen, Amino, C₁-C₄-Alkylamino, Di-(C₁-C₄-alkyl)-amino, Cyano, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht und

R³³ für Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A13)

(A13) steht, in welcher

R³⁴ für Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl steht und

10

15

20 -

25

R³⁵ für Halogen oder C₁-C₄-Alkyl steht,

oder

A für den Rest der Formel (A14)

R³⁶ für Wasserstoff, Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

5

15

20

25

A für den Rest der Formel (A15)

R³⁷ für Halogen, Hydroxy, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkylthio oder C₁-C₄-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A16)

R³⁸ für Wasserstoff, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, Hydroxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, Di(C₁-C₄-alkyl)aminosulfonyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Phenylsulfonyl oder Benzoyl steht,

R³⁹ für Wasserstoff, Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

R⁴⁰ für Wasserstoff, Halogen, Cyano, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

R⁴¹ für Wasserstoff, Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

mit der Maßgabe, dass R40 nicht für Trifluormethyl steht,

oder

A für den Rest der Formel (A17)

(A17) steht, in welcher

 R^{42} für C_1 - C_4 -Alkyl steht.

- 2. Isopentylcarboxanilide der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welcher L für L-1 steht.
- 3. Verfahren zum Herstellen der Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass man
 - a) Carbonsäure-Derivate der Formel (II)

$$A \xrightarrow{X^1}$$

(II),

in welcher

A die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen hat und

X1 für Halogen oder Hydroxy steht,

mit einem Anilin-Derivat der Formel (III)

in welcher L, R¹ und R³ die oben angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators, gegebenenfalls in Gegenwart eines Kondensationsmittels, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt,

oder

b) Isopentylcarboxanilide der Formel (I-a)

$$\begin{array}{c} O \\ A \\ H \\ H \\ C \\ CH_3 \end{array} \qquad (I-a)$$

in welcher

L, A und R³ die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben

15

5

10

20

25

10

15

20

25

mit Halogeniden der Formel (IV)

$$R^{1-A} - X^2$$
 (IV

in welcher

X² für Chlor, Brom oder Iod steht,

für C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl; C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkylsulfonyl, Halogen-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; Formyl, Formyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-Alkyl)-carbonyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl; Halogen-(C₁-C₃-alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, Halogen-(C₁-C₃-alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, Halogen-(C₁-C₃-alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen;

(C₁-C₈-Alkyl)carbonyl, (C₁-C₈-Alkoxy)carbonyl, (C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl)carbonyl, (C₃-C₈-Cycloalkyl)carbonyl; (C₁-C₆-Halogenalkyl)carbonyl, (C₁-C₆-Halogenalkoxy)carbonyl, (Halogen-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl)carbonyl, (C₃-C₈-Halogencycloalkyl)carbonyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlorund/oder Bromatomen; oder -C(=O)C(=O)R⁴, CONR⁵R⁶ oder -CH₂NR⁷R⁸ steht,

wobei R⁴, R⁵, R⁶, R⁷ und R⁸ die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt,

öder

c)

Isopenton-Derivate der Formel (V)

$$\begin{array}{c|c}
A & R^2 \\
R^1 & R^3 \\
H_3C & CH_3
\end{array}$$
(V)

in welcher

R¹, R², R³ und A die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

mit Hydrazin (oder Hydrazin-hydrat) in Gegenwart einer Base und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt,

30 oder

d) Isopenten-Derivate der Formel (VI)

$$\begin{array}{c|c} & & & \\ & & & \\ & & & \\ & & & \\ & & & \\ & & & \\ & & & \\ & & & \\ & & & \\ & & & \\ & & & \\ & & & \\ & & & \\ & & & \\$$

in welcher R1, R2, R3 und A die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators hydriert,

oder

10

15

20

e) Isopentin-Derivate der Formel (VII)

$$\begin{array}{c|c} A & \\ & \\ R^1 & \\ & \\ R_3 & \\ & \\ CH_3 & \end{array}$$
 (VII)

in welcher R¹, R², R³ und A die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators hydriert.

- 4. Mittel zum Bekämpfen unerwünschter Mikroorganismen, gekennzeichnet durch einen Gehalt an mindestens einem Isopentylcarboxanilid der Formel (I) gemäß Anspruch 1 neben Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen.
- 5. Verwendung von Pyrazolylcarboxaniliden der Formel (I) gemäß Anspruch 1 zum Bekämpfen unerwünschter Mikroorganismen.
- 6. Verfahren zum Bekämpfen unerwünschter Mikroorganismen, dadurch gekennzeichnet, dass man Isopentylcarboxanilide der Formel (I) gemäß Anspruch 1 auf die Mikroorganismen und/oder deren Lebensraum ausbringt.
- Verfahren zum Herstellen von Mitteln zum Bekämpfen unerwünschter Mikroorganismen, dadurch gekennzeichnet, dass man Isopentylcarboxanilide der Formel (I) gemäß Anspruch 1 mit Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen vermischt.

8. Anilin-Derivate der Formel (III-b)

$$R^{1-B}$$
 (III-b)

in welcher

a) R^{1-B}

5

10

15

20

25

30

für C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl; C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₄-Halogenalkylsulfonyl, Halogen-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; Formyl, Formyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-Alkyl)-carbonyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl; Halogen-(C₁-C₃-alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, Halogen-(C₁-C₃-alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen;

(C₁-C₈-Alkyl)carbonyl, (C₁-C₈-Alkoxy)carbonyl, (C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl)carbonyl, (C₃-C₈-Cycloalkyl)carbonyl; (C₁-C₆-Halogenalkyl)carbonyl, (C₁-C₆-Halogenalkoxy)carbonyl, (Halogen-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl)carbonyl, (C₃-C₈-Halogencycloalkyl)carbonyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlorund/oder Bromatomen; oder -C(=O)C(=O)R⁴, CONR⁵R⁶ oder -CH₂NR⁷R⁸ steht, und

R^{3-B} für Wasserstoff, Halogen, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Halogenalkyl steht,

oder

b) R^{1-B}

für Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl; C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkylsulfonyl, Halogen-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; Formyl, Formyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-Alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl; Halogen-(C₁-C₃-alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, Halogen-(C₁-C₃-alkyl)mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; (C₁-C₈-Alkyl)carbonyl, (C₁-C₈-Alkoxy)carbonyl, (C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl)carbonyl, (C₃-C₈-Cycloalkyl)carbonyl; (C₁-C₆-Halogenalkyl)carbonyl, (C₁-C₆-Halogenalkoxy)carbonyl, (Halogen-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl)carbonyl, (C₃-C₈-Halogencycloalkyl)carbonyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor-nyl, (C₃-C₈-Halogencycloalkyl)carbonyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor-

und/oder Bromatomen; oder -C(=O)C(=O)R 4 , CONR 5 R 6 oder -CH $_2$ NR 7 R 8 steht, und

 R^{3-B} für Halogen, C_1 - C_8 -Alkyl, C_1 - C_8 -Halogenalkyl steht, und R^2 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 und R^8 jeweils die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben.

9. Isopenton-Derivate der Formel (V)

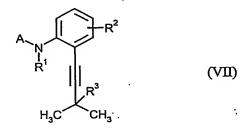
$$\begin{array}{c|c}
A & R^2 \\
R^1 & R^3 \\
R_3 & CH_3
\end{array}$$
(V)

in welcher R¹, R², R³ und A die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben.

10 10. Isopenten-Derivate der Formel (VI)

in welcher R¹, R², R³ und A die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben.

11. Isopentin-Derivate der Formel (VII)



in welcher

15

R¹, R² und R³ die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

A die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen mit Ausnahme von A1 hat.

12. Alkanonaniline der Formel (X)

$$R^{1}$$
 R^{3}
 CH_{3}
 CH_{3}
 (X)

in welcher \mathbb{R}^1 , \mathbb{R}^2 und \mathbb{R}^3 die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben.

Isopentylcarboxanilide

Zusammenfassung

Neue Isopentylcarboxanilide der Formel (I)

$$\begin{array}{c|c}
O \\
A \\
N \\
R^1
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
R^3 \\
CH_3
\end{array}$$

$$\begin{array}{c}
CH_3
\end{array}$$

in welcher L, R¹, R³ und A die in der Beschreibung angegebenen Bedeutungen haben,

mehrere Verfahren zum Herstellen dieser Stoffe und deren Verwendung zum Bekämpfen von unerwünschten Mikroorganismen, sowie neue Zwischenprodukte und deren Herstellung.

This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning Operations and is not part of the Official Record.

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

☐ BLACK BORDERS	
☐ IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES	
☐ FADED TEXT OR DRAWING	
BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING	
☐ SKEWED/SLANTED IMAGES	
☐ COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS	
☐ GRAY SCALE DOCUMENTS	
☐ LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT	

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

OTHER:

As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.

 \square REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY